



Europäisches Patentamt  
European Patent Office  
Office européen des brevets

Veröffentlichungsnummer: 0 279 239  
A1

(2)

## EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(2) Anmeldenummer: 88101183.7.

(5) Int. Cl.: C07D 277/56 , A01N 43/78 ,  
C07D 417/12 , C07F 9/65

(2) Anmeldetag: 27.01.88

(3) Priorität: 30.01.87 CH 351/87

(4) Veröffentlichungstag der Anmeldung:  
24.08.88 Patentblatt 88/34

(6) Benannte Vertragsstaaten:  
AT BE CH DE ES FR GB IT LI NL

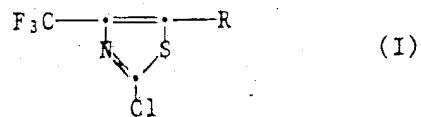
(7) Anmelder: CIBA-GEIGY AG  
Klybeckstrasse 141  
CH-4002 Basel(CH)

(7) Erfinder: Töpfl, Werner, Dr.  
Dorneckstrasse 68  
CH-4143 Dornach(CH)  
Erfinder: Nyfeler, Robert, Dr.  
Bärenfelsstrasse 8  
CH-4057 Basel(CH)  
Erfinder: Föry, Werner, Dr.  
Inzlingerstrasse 11  
CH-4125 Riehen(CH)

(7) Vertreter: Zumstein, Fritz, Dr. et al  
Bräuhausstrasse 4  
D-8000 München 2(DE)

### (5) Mikrobizide Mittel.

(5) Ein mikrobizides Mittel enthält als Wirkstoff ein 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäurederivat der Formel I



EP 0 279 239 A1

in welcher R für einen organischen Rest mit maximal 40 Kohlenstoffatomen, der gegebenenfalls auch Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel enthalten kann und der sich durch Hydrolyse und/oder Oxydation in eine an den Thiazolring gebundene Carboxylgruppe verwandeln lässt, steht.

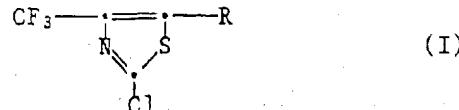
Diese Verbindungen zeichnen sich durch gute mikrobizide Wirkung aus und werden zur Bekämpfung oder Verhütung des Befalls von Pflanzen durch phytopathogene Mikroorganismen verwendet.

Einige dieser Verbindungen sind bekannt, viele neu. Die neuen 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäurederivate und ihre Herstellung sind ebenfalls Gegenstand dieser Erfindung.

Mikrobizide Mittel

Die vorliegende Erfindung betrifft mikrobizide Mittel, die als Wirkstoff mindestens ein 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäurederivat der nachstehenden Formel I enthalten, die Herstellung dieser Verbindungen oder der sie enthaltenden Mittel sowie Verfahren zur Bekämpfung oder Verhütung des Befalls von Pflanzen durch phytopathogene Mikroorganismen.

5 Die Wirkstoffe entsprechen der Formel I



in welcher

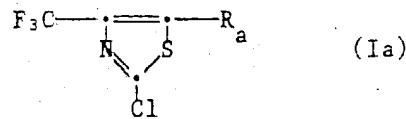
R für einen organischen Rest mit maximal 40 Kohlenstoffatomen, der gegebenenfalls auch Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel enthalten kann und der sich durch Hydrolyse und/oder Oxydation in eine an den Thiazolring gebundene Carboxylgruppe umwandeln lässt, steht.

15 Thiazol-5-carbonsäurederivate sind aus der Literatur bekannt. Im US Patent 3 725 427 werden 2,4-dimethylthiazol-5-carboxamide als Fungizide beschrieben; in den US Patenten 4 199 506, 4 251 261 sowie in den Europäischen Offenlegungsschriften EP-A 27 018, 44 201 und 54 353 sind 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäurederivate als Gegenmittel (Antidots) zur Verminderung der phytotoxischen Wirkung von starken Herbiziden an Kulturpflanzen beschrieben worden.

20 Es hat sich nun gezeigt, dass die erfindungsgemäßen 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäurederivate der Formel I außergewöhnlich gute mikrobizide Wirkung haben und Pflanzen vom Befall von phytopathologischen Mikroben und Pilzen zu schützen oder zu kurieren vermögen.

25 Die Verbindungen der Formel I sind bei Raumtemperatur stabil. Sie lassen sich auf dem Agrarsektor oder verwandten Gebieten insbesondere präventiv und kurativ zur Bekämpfung von pflanzenschädigenden Mikroorganismen einsetzen. Die Wirkstoffe der Formel I zeichnen sich in weiten Anwendungskonzentrationen durch eine sehr gute fungizide Wirkung und problemlose Anwendung aus. Darüber hinaus besitzen die Verbindungen nematicide Eigenschaften, wodurch sie auch zur Bekämpfung von Nematoden, insbesondere 30 von pflanzenschädigenden Nematoden, geeignet sind.

35 Aufgrund ihrer ausgeprägten mikrobiziden Wirksamkeit sind diejenigen Verbindungen der Formel I bevorzugt, worin der organische Rest R maximal 25 Kohlenstoffatome enthält; darunter die Verbindungen, welche unter die Formel Ia fallen,



40 worin  $\text{R}_a$  einen Rest Cyan,  $-\text{COXR}_1$ ,  $-\text{CONR}_2\text{R}_3$  oder  $-\text{CO-D}_X$  Sauerstoff oder Schwefel,

$\text{R}_1$  Wasserstoff;  $\text{C}_1\text{-C}_n$  Alkyl oder  $\text{C}_2\text{-C}_n$  Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder substituiert durch Halogen, eine Gruppe  $-\text{YR}_2$ , A, Nitro,  $-\text{N}(\text{R}_2)\text{COA}$ ,  $-\text{[N}(\text{R}_2)]_m\text{-C(A)}$  =  $\text{NC}_1\text{-C}_n$  Alkyl,  $-\text{[N}(\text{R}_2)]_m\text{-C(A)}$  =  $\text{NH}$  oder  $-\text{[N}(\text{R}_2)]_m\text{-CO-N}[(\text{CO})_m\text{R}_3]$ ,  $-\text{[N}(\text{R}_2)]_m\text{-CON}[(\text{CO})_m\text{-R}_2]\text{-N}(\text{R}_2)_m\text{-CO(R)}_m\text{R}_4$ , in welchem Rest einer der Indices m Null sein muss,

45 ferner kann der  $\text{C}_1\text{-C}_n$  Alkyl- oder  $\text{C}_2\text{-C}_n$  Cycloalkylrest substituiert sein durch Cyano, einen Rest  $-\text{C}(\text{X})_m\text{-XR}_{10}$ ,  $-\text{XCXR}_{10}$ ,  $-(\text{X})_m\text{-CXA}$ ,  $-(\text{X})\text{CXN}(\text{R}_2)\text{N}(\text{R}_2)\text{R}_4$ ,  $-\text{CHA-COOR}_{10}$ ,  $-\text{C}(\text{OR})_2(\text{OR}_2)\text{R}_8$ ,  $-\text{PO}(\text{R}5)\text{R}_6$ ,  $\text{C}_3\text{-C}_4$ -Cycloalkyl oder  $\text{C}_2\text{-C}_4$  Cycloalkenyl;  $\text{R}_2$  ist ferner  $\text{C}_3\text{-C}_6$  Alkenyl oder  $\text{C}_2\text{-C}_4$  Cycloalkenyl, welches unsubstituiert oder substituiert ist durch Halogen,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  Alkoxy,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  Alkylthio,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  Halogenalkoxy,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  Halogenalkyl oder einen Rest  $-\text{CO(O)}_m\text{-R}_{10}$ ,  $-\text{COA}$ ,  $-\text{CON(A)}\text{R}_6$  oder  $-\text{PO}(\text{R}_2)\text{R}_6$ ,  $\text{R}_4$  ist ferner  $\text{C}_3\text{-C}_6$  Alkinyl, welches unsubstituiert ist oder ein Rest  $-(\text{E})_m\text{U}$  oder  $-(\text{E})_m\text{-Q}$ .

50  $\text{R}_2$   $\text{C}_1\text{-C}_6$  Alkyl oder  $\text{C}_2\text{-C}_6$  Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder durch  $\text{C}_1\text{-C}_6$  Alkoxy,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  Alkylthio,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  Alkoxyalkoxy, Halogen, Cyan oder einen Rest  $-\text{CX(X)}_m\text{R}_{10}$ ,  $-(\text{X})_m\text{-CX-A}$ ,  $-(\text{X})_m\text{CXR}_{10}$ ,  $\text{N}(\text{R}_2)\text{COA}$ ,  $-\text{[N}(\text{R}_2)]_m\text{-C(A)}$  =  $\text{NH}$ ,  $-\text{[N}(\text{R}_2)]_m\text{-C(A)}$  =  $\text{NC}_1\text{-C}_n$  Alkyl, A,  $-\text{X-U}$  oder  $-\text{X-Q}$  substituiert ist,  $\text{R}_2$  bedeutet ferner  $\text{C}_3\text{-C}_6$  Alkenyl oder  $\text{C}_2\text{-C}_6$  Cycloalkenyl, welches unsubstituiert oder durch Halogen substituiert ist, oder einen Rest  $-(\text{E})_m\text{U}$  oder

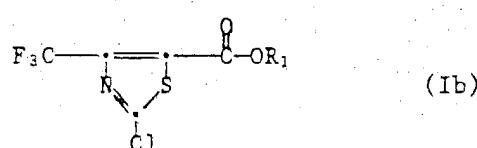
$-(E)_m Q;$ 

m ist Null oder 1;

Y ist Sauerstoff, Schwefel, SO oder  $SO_2$ ;A ist ein Rest  $-N(R_3)R_4$ ,5 D ist ein Rest  $-N(R_3)N(R_4)(CO)_m R_5$ ,R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> sind unabhängig voneinander je Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkoxyalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkylothio, Cyano, einen Rest -COOR<sub>10</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkylcarbamoyl, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkylcarbamoyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkylamino, Piperidinocarbonyl, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidino oder Pyrrolidino substituiert ist; R<sub>5</sub> und R<sub>6</sub> sind ferner C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkenyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>Cycloalkenyl,10 15 welches unsubstituiert oder substituiert ist durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Cycloalkenyl, oder einen Rest Cyan, -COOR<sub>6</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkylcarbamoyl, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkylcarbamoyl, U, Pyrrolidino-carbamoyl oder Piperidinocarbamoyl substituiert ist, R<sub>5</sub> und R<sub>6</sub> sind ferner C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkinyl, welches unsubstituiert oder durch U substituiert ist, oder R<sub>5</sub> und R<sub>6</sub> bedeuten einen Rest -(E)<sub>m</sub>-U oder -(E)<sub>m</sub>-Q,R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bilden auch einen gesättigten oder ungesättigten 5 - 9gliedrigen Heterocyclus, der ein-oder mehrfach durch Sauerstoff, Schwefel, Stickstoff, -NH-, -NC-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkyl, -CO- oder -C(OR<sub>7</sub>)OR<sub>8</sub>-unterbrochen und durch Halogen, Cyan, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkylamino, oder einen Rest -COOR<sub>6</sub> substituiert sein kann;R<sub>5</sub> und R<sub>6</sub> sind unabhängig voneinander je Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>Alkoxy;R<sub>5</sub> und R<sub>6</sub> sind unabhängig voneinander je C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkyl oder R<sub>5</sub> und R<sub>6</sub> bilden zusammen eine 2 - 4 gliedrige 20 Alkenenkette,R<sub>5</sub> und R<sub>6</sub> sind unabhängig voneinander je Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkoxyalkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Halogenalkyl, -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkyl)<sub>m</sub>U, -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkyl)<sub>m</sub>Q, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Halogenalkyloxy C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl;U ist ein Phenyl-oder Naphthylrest, der unsubstituiert oder ein-oder mehrfach durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkyl, -Y-25 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Halogenalkoxy, Cyano, Nitro, -COOH, -COOR<sub>7</sub>, -CONH<sub>2</sub>, -CONHR<sub>8</sub>, -CON(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>NHR<sub>8</sub>, SO<sub>2</sub>N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub>, Pyrrolidino, Piperidino, Pyrrolidinocarbonyl oder Piperidinocarbonyl substituiert ist.E ist eine C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkylen, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>Alkenylenkette, die unsubstituiert oder durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Alkylothio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>Halogenalkoxy oder einen Rest -CO(O)<sub>m</sub>R<sub>10</sub>, (CO)<sub>m</sub>A, -(CO)<sub>m</sub>Q substituiert und/oder durch30 ein Glied -CO- oder -C(OR<sub>7</sub>)OR<sub>8</sub>-unterbrochen ist, Q ist ein gesättigter oder ungesättigter 5 - 12 gliedriger Heterocyclus, der 1 - 4 Heteroatome oder eine Sulfinyl-oder Sulfonylgruppe auch in Kombination mit 1 - 2 Heteroatomen enthalten kann, der durch eine oder zwei Carbonylgruppen unterbrochen und benzanneliert sein kann.

Gute mikrobizide Wirkung zeigen insbesondere auch die Verbindungen der Formel Ib

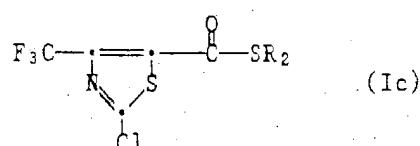
35



worin R, die oben gegebene Bedeutung hat.

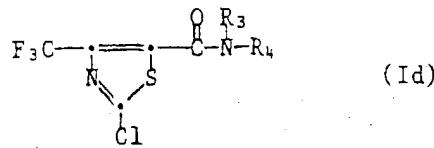
Ebenfalls gute Wirkung zeigen die Verbindungen der Formel Ic

45



50 worin R, die oben gegebene Bedeutung hat, sowie die Verbindungen der Formel Id

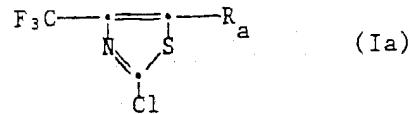
55



worin R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> die oben gegebene Bedeutung haben.

Einige dieser 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäurederivate-Wirkstoffe sind bekannt, grösstenteils handelt es sich jedoch um neue Verbindungen. Die neuen Verbindungen und ihre Herstellung bilden ebenfalls einen Gegenstand dieser Erfindung.

Neu sind die 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäurederivate der Formel Ia



20 in denen R<sub>a</sub> einen Rest Cyan, -COXR<sub>1</sub>, -CONR<sub>2</sub>R<sub>3</sub> oder -COD bedeutet, worin R<sub>1</sub>, D und X die oben gegebene Bedeutung haben und R<sub>1</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Cycloalkyl unsubstituiert, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> oder C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> substituiert durch Halogen, eine Gruppe -YR<sub>2</sub>, A, Nitro, -N(R<sub>2</sub>)COA, -[N(R<sub>2</sub>)]<sub>m</sub>-C(A) = NC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> Alkyl, -[N(R<sub>2</sub>)]<sub>m</sub>-C(A) = NH oder -[N(R<sub>2</sub>)]<sub>m</sub>-CO-N[(CO)<sub>m</sub>R<sub>2</sub>]-N(R<sub>2</sub>), -[N(R<sub>2</sub>)]<sub>m</sub>-CON[(CO)<sub>m</sub>-R<sub>3</sub>]-N(R<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-(CO)<sub>m</sub>R<sub>4</sub>, in welchem Rest einer der Indices m Null sein muss, ferner kann der C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> Alkyl-oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> Cycloalkylrest substituiert sein durch Cyano, einen Rest -C(X)<sub>m</sub>-XR<sub>10</sub>, -XCXR<sub>10</sub>, -(X)<sub>m</sub>-CXA, -(X)CXN(R<sub>2</sub>)N(R<sub>2</sub>)R<sub>4</sub>, -CHA-COOR<sub>10</sub>, -C(OR<sub>7</sub>)-(OR<sub>7</sub>)R<sub>4</sub>, -PO(R<sub>5</sub>)R<sub>6</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Cycloalkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Cycloalkenyl; mit der Massgabe, dass -XR<sub>1</sub> nicht C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> Halogenalkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Alkoxyalkoxy, Phenylthio, Benzyloxy ist, es sei denn, diese Reste seien substituiert. R<sub>1</sub> darf auch nicht substituiertes oder unsubstituiertes Phenoxy sein;

25 R<sub>1</sub> bedeutet ferner C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Alkenyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Cycloalkenyl, welches unsubstituiert oder substituiert ist durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkylothio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Halogenalkyl oder einen Rest -CO(O)<sub>m</sub>-R<sub>10</sub>, -COA, -CON(A)R<sub>4</sub> oder -PO(R<sub>5</sub>)R<sub>6</sub>, mit der Massgabe, dass -XR<sub>1</sub> nicht einen unsubstituierten C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Alkenyloxyrest bedeutet, R<sub>1</sub> ist ferner C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Alkinyl, welches unsubstituiert ist, falls X Schwefel bedeutet, R<sub>1</sub> ist auch ein Rest (E)<sub>m</sub>-U oder -(E)<sub>m</sub>-Q, R<sub>2</sub> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkylothio, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Alkoxyalkoxy, Halogen, Cyan oder einen Rest -CS(X)<sub>m</sub>R<sub>10</sub>, -(X)<sub>m</sub>-CX-A, -(X)<sub>m</sub>-CXR<sub>10</sub>, -N(R<sub>2</sub>)COA, -[N(R<sub>2</sub>)]<sub>m</sub>-C(A) = NH, -[N(R<sub>2</sub>)]<sub>m</sub>-C(A) = NC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkyl, A, -X-U oder -XQ substituiert ist, R<sub>2</sub> bedeutet ferner C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Alkenyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Cycloalkenyl, welches unsubstituiert oder durch Halogen substituiert ist, oder einen Rest -(E)<sub>m</sub>U oder -(E)<sub>m</sub>Q;

30 m ist Null oder 1;

Y ist Sauerstoff, Schwefel, SO oder SO<sub>2</sub>,

A ist ein Rest -N(R<sub>2</sub>)R<sub>4</sub>,

40 D ist ein Rest -N(R<sub>2</sub>)N(R<sub>2</sub>)(CO)<sub>m</sub>R<sub>10</sub>,

R<sub>1</sub> und R<sub>2</sub> sind unabhängig voneinander je Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Alkoxyalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkylothio, Cyan, einen Rest -COOR<sub>10</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkylcarbamoyl, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkylcarbamoyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkylamino, Piperidinocarbonyl, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidino oder Pyrrolidino substituiert ist; R<sub>1</sub> und R<sub>2</sub> sind ferner C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Alkenyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Cycloalkenyl, welches unsubstituiert oder substituiert ist durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Cycloalkenyl, oder einen Rest Cyan, -COOR<sub>10</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkylcarbamoyl, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkylcarbamoyl, U, Pyrrolidino-carbamoyl oder Piperidinocarbamoyl substituiert ist, R<sub>1</sub> und R<sub>2</sub> sind ferner C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Alkinyl, welches unsubstituiert oder durch U substituiert ist, oder R<sub>1</sub> und R<sub>2</sub> bedeuten einen Rest -(E)<sub>m</sub>U oder (E)<sub>m</sub>Q, mit der Massgabe, dass nur eines von R<sub>1</sub> und R<sub>2</sub> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkyl bedeutet,

45 R<sub>1</sub> und R<sub>2</sub> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bilden auch einen gesättigten oder ungesättigten 5 - 9 gliedrigen Heterocyclus, der ein-oder mehrfach durch Sauerstoff, Schwefel, Stickstoff, -NH-, -NC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkyl, -CO-oder -C(OR<sub>7</sub>)OR<sub>7</sub>-unterbrochen und durch Halogen, Cyan, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkylamino, oder einen Rest -COOR<sub>10</sub> substituiert sein kann;

50 R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> unabhängig voneinander je Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Alkoxy;

R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> sind unabhängig voneinander je C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkyl oder R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> bilden zusammen eine 2 - 4 gliedrige Alkylenkette,

55 R<sub>5</sub> und R<sub>10</sub> sind unabhängig voneinander je Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Cycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>Alkenyl, C<sub>2</sub>-

C<sub>2</sub>Cycloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkinyl, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkoxyalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Halogenalkyl, -(C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkyl)<sub>m</sub>U, --(C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkyl)<sub>m</sub>Q, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Halogenalkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Halogenalkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>alkyl;

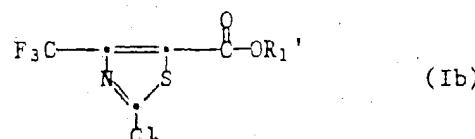
U ist ein Phenyl-oder Naphthylrest, der unsubstituiert oder ein-oder mehrfach durch Halogen, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkyl, -Y-C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Halogenalkoxy, Cyano, Nitro-carboxyl, -COOR, -CONH<sub>2</sub>, -CONHR, -CON(R<sub>2</sub>)<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>NHR<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>N(R<sub>2</sub>)<sub>2</sub>, Pyrrolidino, Piperidino, Pyrrolidinocarbonyl oder Piperidinocarbonyl substituiert ist.

E ist eine C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkylen, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkenylenkette, die unsubstituiert oder durch Halogen, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkylthio, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Halogenalkoxy oder einen Rest -CO(O)<sub>m</sub>R<sub>10</sub>, (CO)<sub>m</sub>A, -(CO)<sub>m</sub>Q substituiert und/oder durch ein Glied -CO-oder -C(OR<sub>1</sub>)OR<sub>1</sub>-unterbrochen ist,

- 10 Q ist ein gesättigter oder ungesättigter 5 - 12gliedriger Heterocyclicus, der 1 - 4 Heteroatome oder eine Sulfinyl-oder Sulfonylgruppe auch in Kombination mit 1 - 2 Heteroatomen enthalten kann, der durch eine oder zwei Carbonylgruppen unterbrochen und benzanneliert sein kann.

Neu sind ferner die 2-Chlor-4-trifluoromethyl-thiazol-5-carbonsäurederivate der Formel Ib

15



20

worin R<sub>1'</sub> C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Cycloalkyl unsubstituiert oder substituiert durch Halogen oder C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkyl-, oder C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Cycloalkyl substituiert durch eine Gruppe XR<sub>1</sub>, A, Nitro, -N(R<sub>2</sub>)COA, -[N(R<sub>2</sub>)]<sub>m</sub>-C(A) = N-C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkyl, -N(R<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-C(A) = NH, oder [N(R<sub>2</sub>)]<sub>m</sub>-CON[(CO)<sub>m</sub>R<sub>1</sub>]NR<sub>3</sub>, -[N(R<sub>2</sub>)]<sub>m</sub>-CON[(CO)<sub>m</sub>-R<sub>1</sub>]-N(R<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(CO)<sub>m</sub>R<sub>4</sub>, in welchem Rest einer der Indices m Null sein muss, ferner kann der C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkyl-oder C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Cycloalkylrest substituiert sein durch Cyano, einen Rest -C(X)<sub>m</sub>-XR<sub>10</sub>, -XCXR<sub>10</sub>, -(X)<sub>m</sub>-CXA, -(X)CXN(R<sub>2</sub>)N(R<sub>3</sub>)-R<sub>4</sub>, -CHA-COOR<sub>10</sub>, -C(OR<sub>1</sub>)(OR<sub>2</sub>)R<sub>4</sub>, PO(R<sub>2</sub>)R<sub>4</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Cycloalkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Cycloalkenyl. R<sub>1'</sub> bedeutet ferner einen unsubstituierten C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkenyl-oder C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Cycloalkenylrest oder einen C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkenyl-oder C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Cycloalkenylrest, der substituiert ist durch Halogen, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkylthio, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Halogenalkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Halogenalkyl oder einen Rest -CO(O)<sub>m</sub>-R<sub>10</sub>, -COA, -CON(A)R<sub>1</sub> oder -PO(R<sub>2</sub>)R<sub>4</sub>. R<sub>1'</sub> ist ferner C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkinyl, welches unsubstituiert ist oder ein Rest -(E)<sub>m</sub>U oder -(E)<sub>m</sub>Q mit der Massgabe, dass (E)<sub>m</sub>U nicht einen unsubstituierten Benzylrest oder einen unsubstituierten oder substituierten Phenylrest bedeutet, während m, X, Y, A, D, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>6</sub>, R<sub>7</sub>, R<sub>8</sub>, R<sub>9</sub>, R<sub>10</sub>, U, E und Q die unter der Formel Ia gegebene Bedeutung haben.

Speziell gute Wirkung zeigten diejenigen 2-Chlor-4-trifluoromethylthiazol-5-carbonsäurederivate der Formel Ib, in denen R<sub>1'</sub> einen C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkyrest bedeutet, der substituiert ist durch Halogen, Cyan, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkylthio, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkylsulfonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkyl-carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Cycloalkyl oder einen Rest -(E)<sub>m</sub>U oder -(E)<sub>m</sub>Q, wobei E, m und Q die oben gegebene Bedeutung haben; darunter insbesondere diejenigen Verbindungen, in denen R<sub>1</sub> einen Rest

- Tetrahydropyran-2-ylmethyl-
- 40 2,2-Dimethyl-1,3-dioxolan-4-ylmethyl-
- 1,2-Dihydrobenz-1,4-dioxan-2-ylmethyl-
- Thiophen-2-ylmethyl-
- 3,4 Methylendioxybenzyl-
- 5-Methylthiazol-4-ylethyl-
- 45 para Tolyl-eth-1-yl
- Bornyl-
- Norbornyl-
- Fenchyl-
- Menthyl-
- 50 Cyanoethyl-
- Phenoxyethyl-
- Methylsulfonylethyl
- Phenylthioethyl-
- Ethoxycarbonylmethyl-
- 55 Ethoxycarbonyleth-1-yl-
- 5,5-Diemethyl-tetrahydrofuran-2-on-3-yl-
- 2-Oxopyrrolinomethyl-
- $\alpha$ -Methoxycarbonyl-benzyl-

$\alpha$ -Cyano-benzyl-

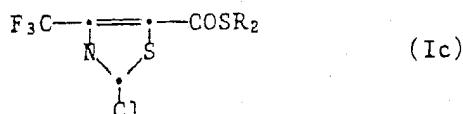
$\alpha$ -Benzoyl-benzyl-oder

$\alpha$ -Methoxycarbonyl- $\alpha$ -phenyl-benzyl-oder den Morpholinomethylrest bedeutet.

Gute Wirkung zeigen auch die Verbindungen der Formel Ib, in denen R, einen C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylrest bedeutet, der durch -(X)<sub>m</sub>CXA substituiert ist, wobei A, m und X die oben gegebene Bedeutung haben; besonders diejenigen, in denen m Null, X, Sauerstoff bedeutet; insbesondere diejenigen, in denen R, einen Azepinoethyl-, N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(methoxycarbonyleth-1-yl)-carbonyl-methyl-oder 2-Piperidino-eth-2-ylrest bedeutet.

Neu sind die 2-Chlor-4-trifluoromethyl-thiazol-5-thiocarbonsäurederivate der Formel Ic,

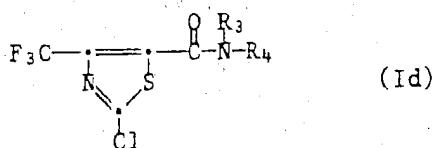
10



15

worin R<sub>2</sub> die unter der Formel Ia gegebene Bedeutung hat. Neu sind ebenfalls die 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäureamide der Formel Id

20



25

worin R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> unabhängig voneinander je Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>n</sub>Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub>Alkoxyalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylthio, Cyano, einen Rest -COOR<sub>10</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylcarbamoyl, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylcarbamoyl, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylamino, Piperidinocarbonyl, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidino oder Pyrrolidino substituiert ist; R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> sind ferner C<sub>3</sub>-C<sub>n</sub>Alkenyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Cycloalkenyl, welches unsubstituiert oder substituiert ist durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>n</sub>Cycloalkenyl, oder einen Rest Cyan, -COOR<sub>10</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylcarbamoyl, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylcarbamoyl, U, Pyrrolidino-carbamoyl oder Piperidinocarbamoyl substituiert ist, R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> sind ferner C<sub>3</sub>-C<sub>n</sub>Alkinyl, welches unsubstituiert oder durch U substituiert ist, oder R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> bedeuten einen Rest -(E)<sub>m</sub>-U oder -(E)<sub>m</sub>-Q, sind, mit der Massgabe, dass nur eines von beiden Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkyl ist, und

30

R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bilden auch einen gesättigten oder ungesättigten 5 - 9 gliedrigen Heterocyclus, der ein-oder mehrfach durch Sauerstoff, Schwefel, Stickstoff, -NH-, -NC-, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkyl, -CO-oder -C(OR<sub>10</sub>)OR<sub>10</sub>-unterbrochen und durch Halogen, Cyan, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylamino, oder einen Rest -COOR<sub>10</sub> substituiert sein kann; wobei E, m, Q, R<sub>10</sub> und U die unter der Formel Ia gegebene Bedeutung haben.

35

Von diesen Amiden wirken diejenigen besonders gut, in denen

40

-CON(R<sub>2</sub>)R<sub>4</sub> einen Rest

-N 2,4-Dichlorbenzyl-N-methylcarbamoyl-,

-N-Benzyl-N-isopropylcarbamoyl-,

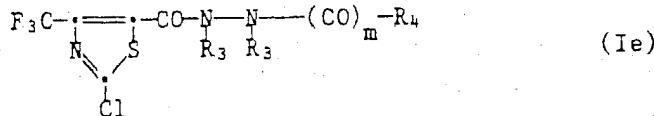
-N-Cyclohexyl-N-methoxycarbonylethyl-carbamoylamin-,

-N-2,6-Dimethylphenyl-N-methoxycarbonyleth-1-yl-carbamoyl-oder den -N-(1-Cyanopent-1-yl)-N-methylcarbamoylrest bedeutet.

45

Neu sind weiter die 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäurehydrazide der Formel Ie

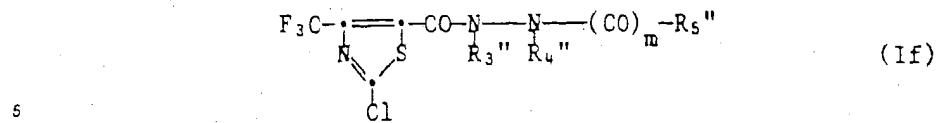
50



worin m, die R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> unabhängig voneinander eine unter der Formel Ia gegebene Bedeutung haben.

55

Darunter zeigten die Verbindungen der Formel If besonders gute Wirkung.



worin  $R_3''$ ,  $R_4''$  und  $R_5''$  unabhängig voneinander je Wasserstoff,  $C_1\text{-}C_6$ -Alkyl,  $C_1\text{-}C_6$ -Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyl bedeuten, wobei Phenyl und Benzyl unsubstituiert, oder durch Halogen,  $C_1\text{-}C_6$ -Alkyl,  $C_1\text{-}C_6$ -Haloalkyl,  $C_1\text{-}C_6$ -Alkoxy,  $C_1\text{-}C_6$ -Haloalkoxy, Nitro, Carboxyl,  $C_1\text{-}C_6$ -Alkoxyxcarbonyl, Carbamoyl, Methylcarbamoyl, substituiert ist oder  $R_3''$  und  $R_4''$  zusammen auch eine 4-5gliedrige Alkylenkette bilden, die durch Sauerstoff, Schwefel, Imino oder  $C_1\text{-}C_6$ -Alkylimino unterbrochen sein kann und die ein-oder mehrmals durch  $C_1\text{-}C_6$ -Alkyl substituiert sein kann, bedeuten.

In diesen Definitionen werden unter Alkylresten Reste mit 1 bis 18 Kohlenstoffatomen verstanden. Diese Reste können geradkettig oder verzweigt sein. Die gebräuchlichsten Reste sind beispielsweise Methyl, Aethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sek. Butyl, tert. Butyl, n-Pentyl, Isopentyl, n-Hexyl und n-Octyl. Die Alkenyl- und Alkinylreste können ebenfalls geradkettig oder verzweigt sein und umfassen 3 bis 18 Kohlenstoffatome. Die am verbreitetsten Reste sind beispielsweise Allyl, Methallyl, Buten, Butadien, Propenyl, Methylpropenyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl. Cycloalkyl- oder Cycloalkenylreste haben vorzugsweise 3 - 12 Kohlenstoffatome, sie können auch benzannelliert sein. Typische Vertreter sind beispielsweise Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclohexenyl, Indan, Tetrahydronaphthalin, Decalin. Unter Halogen wird Fluor, Chlor, Brom, Jod, insbesondere Fluor und Chlor verstanden. Halogenalkyl- und Halogenalkenyl-Reste können ein-oder mehrfach mit Halogen substituiert sein.

Die obgenannten Reste können unsubstituiert oder substituiert sein. Typische Substituenten dieser Reste sind beispielsweise die Halogenatome, über Sauerstoff, Schwefel oder eine Iminogruppe gebundene Alkyl-, Alkenyl-, Alkinyl-, oder Cycloalkyl-, Aryl- oder Aralkylreste, die ihrerseits wieder substituiert sein können. Diese Substituenten können aber auch über eine Sulfinyl-, Sulfonyl-, Carbonyl-, Carbonyloxy, Carbonylthio, Carbamoyl-, Sulfamoyl- oder eine Amino-oxybrücke an die alicyclischen Kohlenwasserstoffreste gebunden sein.

Der Substituent Q aber auch die Reste  $R_3''$  und  $R_4''$  können zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, auch einen gesättigten oder ungesättigten 5 bis 12-gliedrigen Heterocyclus bilden, der noch ein, zwei oder drei weitere Heteroatome oder eine Sulfinyl- resp. Sulfonylgruppe enthält, durch ein oder zwei Carbonylgruppen unterbrochen sein kann, und welcher benzannelliert, unsubstituiert oder substituiert sein kann.

Als Heteroatome kommen dabei ein, zwei oder drei weitere Stickstoffatome, bis zwei Schwefel- oder Sauerstoffatome in Frage, wobei 2 Sauerstoffatome nicht direkt benachbart sein können

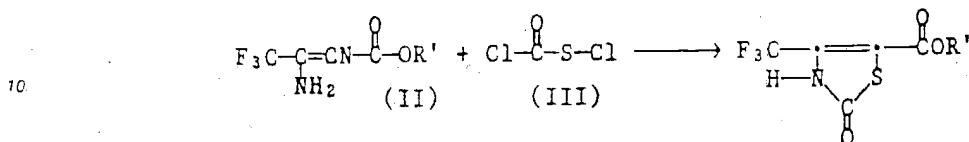
Beispiele für solche Heterocyclen sind untenstehend aufgeführt: Pyrrolin, Pyrrolidin, Imidazolin, Imidazolidin, Pyrazolin, Pyrazolidin, Isoxazolin, Isoxazolidin, Oxazolin, Oxazolidin, Isothiazolidin, Thiazoline, Thiazolidine, Dithiazolidine, Oxadiazolidine, Piperidin, Piperazin, Tetrahydropyrimidin und -pyrazin, Morpholin, Thiomorpholin, Thiazine, Hexahydrotriazine, Tetrahydrotriazine, Oxadiazine; Oxatriazine, Hexahydroazepin, Hexahydrodiazepine, Diazepine, Hexahydrooxazepine, Azacyclooctan, Indolin, Isoindolin, Benzimidazolin, Benzindazolin, Benzoxazolin, Benzthiazoline, Benzisoxazolin, Benztriazol, Tetrahydrochinolin, Tetrahydroiso-chinolin, Tetrahydrochinazolin, Tetrahydrochinolin, Tetrahydropthalazin, Benzmorpholin, Benzothiomorpholin, Tetrahydrobenzazepine und Tetrahydrodiazepine, Tetrahydrobenzoxazepine, 1,5-diazabicyclo[4.3.0]nonane, Dihydrobenzoxazine, 1,6-diazabicyclo[5.3.0]decane, 1,4-diazabicyclo[3.3.0]octane, 1,5-diazabicyclo[4.4.0]decane.

Oben erwähnte Heterocyclen können auch die Bedeutung von Substituenten haben. Weitere Beispiele von heterocyclischen Systemen mit Substituentenfunktion sind beispielsweise Pyrrol, Imidazol, Pyrazol, Isoxazol, Oxazol, Isothiazol, Thiazol, Triazole, Oxadiazole, Thiadiazole, Tetrazole, Oxatriazole, Thiatriazole, Furan, Tetrahydrofuran, Dioxole, Dioxolane, Oxathiol, Oxathioliene, Thiophen, Tetrahydrothiophen, Dithiolane, Dithiazole, Pyridin, Pyrane, Thiopyrane, Pyridazin, Pyrimidin, Pyrazin, Tetrahydropyran, Tetrahydro-thiopyran, Dioxine, Dioxane, Dithiine, Dithiane, Oxazine, Thiazine, Oxathiine, Oxathiane, Triazine, Oxadiazine, Thiadiazine, Oxathiazine, Dioxazine, Azepine, Oxepine, Thiepine, Diazepine, Oxazepine, Indole, Benzfuran, Benzothiophene, Indazole, Benzimidazole, Benzidoxole, Benzidhiole, Benzisoxazole, Benzthiazole, Benzoxazole, Benzoxathiole, Benztriazole, Benzoxadiazole, Benzofurazan, Benzothiadiazole, Chinolin, Isochinolin, Chromene, Chroman, Isochromen, Isochroman, Thiochromene, Isothiochromene, Thiochroman, Isothiochroman, Cinnolin, Chinazolin, Chinoxalin, Phtalazin, Benzidoxine, Benzidhine, Benzoxazine, Benzidoxane, Benzoxathiane, Benzotriazine, Benzazepine, Benzidazepine, Benzoxazepine, Purine, Pteridine, Phenoxazine, Phenothiazine.

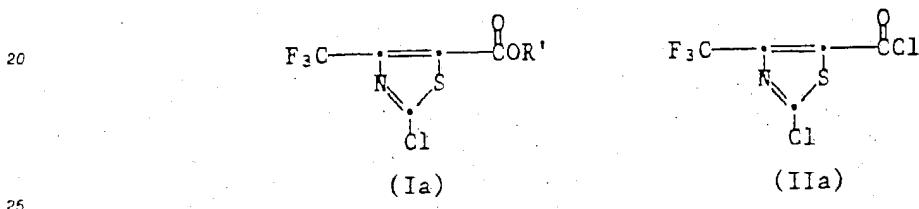
Die heterocyclischen Reste können wie oben erwähnt substituiert sein.

Die Verbindungen der Formel I sind grösstenteils aus der Literatur bekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden.

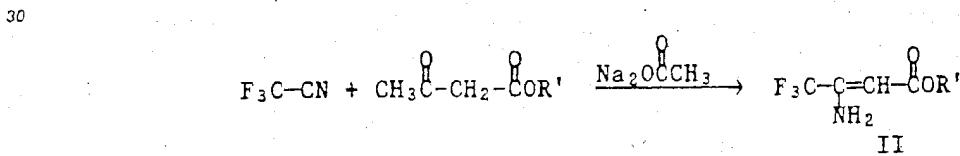
Die Thiazol-5-carbonsäurederivate der Formel I werden z.B. gemäss USP 4,199,506 hergestellt, indem man einen Acrylsäureester der Formel II mit Chlorcarbonyl-sulfonylchlorid der Formel III umsetzt, entsprechend der Gleichung



Das entstandene 2-Oxo-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäurederivat wird mit Phosphoroxychlorid behandelt, wobei entsprechend den Reaktionsbedingungen und der Menge Phosphoroxychlorid ein 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäurederivat der Formel Ia oder 2-Chlor-4-trifluormethylthiazol-carbonsäurechlorid der Formel IIa entsteht:



Die Acrylsäurederivate der Formel III können gemäss J. Het. Chem. 9 (1972) 513 hergestellt werden, indem man einen Acetoessigessigester mit Trifluormethylnitril umsetzt in Gegenwart von Natriumacetat in siedendem Lösungsmittel



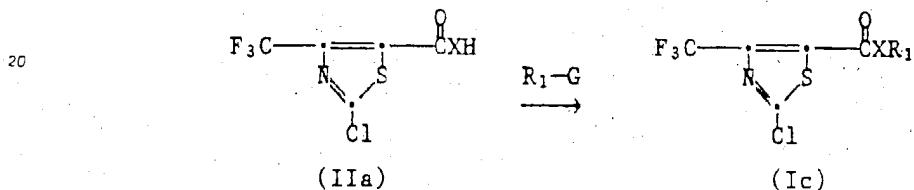
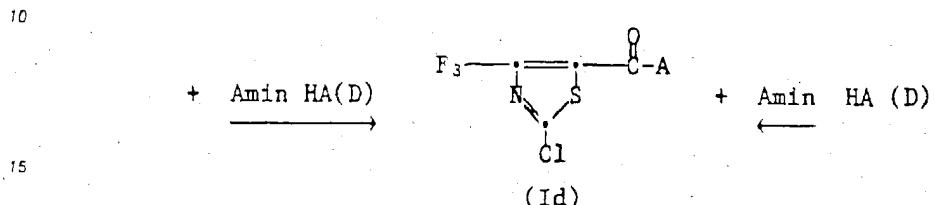
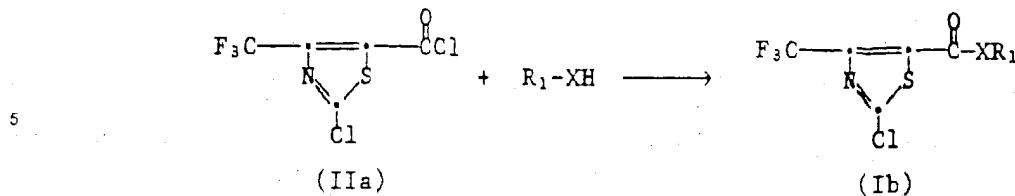
Ausgehend vom 2-Chlor-4-trifluormethylthiazol-5-carbonsäurechlorid können nach bekannten Methoden und entsprechend den folgenden Reaktionsschemen weitere Wirkstoffe der Formel I hergestellt werden:

40

45

50

55



20

25 In diesen Formeln haben A und R<sub>1</sub> die oben gegebene Bedeutung, während G eine nukleofuge Abgangsgruppe z.B. ein Halogenatom, ein aromatischer oder Niederalkyl-sulfoxyloxyrest bedeutet.

In diesen Umsetzungen werden in Anpassung an die jeweiligen Reaktionsbedingungen inerte Lösungs- und Verdünnungsmittel verwendet. Als Beispiele sind zu nennen:

30 Halogenkohlenwasserstoffe, insbesondere Chlorkohlenwasserstoffe, wie Tetrachlorethen, Tetrachlorethan, Dichlorpropan, Methylenchlorid, Dichlorbutan, Chloroform, Chlornaphthalin, Dichlornaphthalin, Tetrachlorkohlenstoff, Trichlorethan, Trichlorethen, Pentachlor ethan, Difluorbenzol, 1,2-Dichlorethan, 1,1-Dichlorethan, 1,2-cis-Dichlorethen, Chlorbenzol, Fluorbenzol, Brombenzol, Jodbenzol, Dichlorbenzol, Dibrombenzol, Chlortoluol; Trichlorbenzol; Ether, wie Ethylpropylether, Methyl-tret.-butylether, n-Butylethylether, Di-n-butylether, Di-isobutylether, Diisoamylether, Diisopropylether, Anisol, Phenetol, Cyclohexylmethylether, Diethylether, Ethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Thioanisol, Dichlordiethylether; Nitrokohlenwasserstoffe wie Nitromethan, Nitroethan, Nitrobenzol, Chlornitrobenzol, o-Nitrotoluol; Nitrile wie Acetonitril, Butyronitril, Isobutyronitril, Benzonitril, m-Chlorbenzonitril; aliphatische oder cycloaliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Heptan, Pinan, Nonan, Cymol, Benzinfraktionen innerhalb eines Siedepunktintervales von 70° bis 40 190°C, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Dekalin, Petrolether, Hexan, Ligroin, Trimethylpentan, Trimethylpentan, 2,3,3-Trimethylpentan, Octan; Ester wie Ethylacetat, Acetessigester, Isobutylacetat; Amide, z.B. Formamid, Methylformamid, Dimethylformamid.

45 Es wurde nun überraschend gefunden, dass die erfindungsgemäßen Mittel, die Verbindungen der Formel I als Aktivstoffe enthalten, ein für praktische Bedürfnisse sehr günstiges Mikrobizid-Spektrum gegen phytopathogene Pilze und Bakterien aufweisen. Sie besitzen sehr vorteilhafte kurative, systemische und insbesondere präventive Eigenschaften und lassen sich zum Schutz von zahlreichen Kulturpflanzen einsetzen. Mit den Wirkstoffen der Formel I können an Pflanzen oder an Pflanzenteilen (Früchte, Blüten, Laubwerk, Stengel, Knollen, Wurzeln) von unterschiedlichen Nutzkulturen die auftretenden Mikroorganismen eingedämmt oder vernichtet werden, wobei auch später zuwachsende Pflanzenteile von derartigen Mikroorganismen verschont bleiben.

50 Die Wirkstoffe der Formel I sind gegen die den folgenden Klassen angehörenden phytopathogenen Pilze wirksam: Fungi imperfecti (z.B. Botrytis, Helminthosporium, Fusarium Septoria, Cercospora und Alternaria); Basidiomyceten (z.B. die Gattungen Hemileia, Rhizoctonia, Puccinia); ferner wirken sie gegen die Klasse der Ascomyceten (z.B. Venturia, Podosphaera, Erysiphe, Monilia, Uncinula). Ueberdies wirken die Verbindungen der Formel I systemisch. Sie können ferner als Beizmittel zur Behandlung von Saatgut (Früchte, Knollen, Körner) und Pflanzenstecklingen zum Schutz von Pilzinfektionen sowie gegen im Erdboden auftretende phytopathogene Pilze eingesetzt werden.

Neben der mikrobiziden Wirksamkeit weisen die Wirkstoffe der Formel I nematizide Eigenschaften auf,

was sie insbesondere zur Bekämpfung von Pflanzennematoden geeignet macht. Zu diesem Zweck können die erfindungsgemässen Mittel kreativ, präventiv oder systemisch eingesetzt werden. Dabei entfalten sie eine breit gefächerte Aktivität gegen die verschiedenen Nematodenspecies und werden somit den Erfordernissen der Praxis gerecht.

- 5 Die erfindungsgemässen Wirkstoffe zeichnen sich durch besonders gute Pflanzenverträglichkeit aus.  
 Die Erfindung betrifft auch die Verwendung der Verbindungen der Formel I zur Bekämpfung phytopathogener Mikroorganismen, insbesondere pflanzenschädigender Pilze bzw. die präventive Verhütung eines Befalls von Pflanzen.

10 Darüber hinaus schliesst die vorliegende Erfindung auch die Herstellung agrochemischer Mittel ein, die gekennzeichnet ist durch das innige Vermischen der Aktivsubstanz mit einem oder mehreren hierin beschriebenen Substanzen bzw. Substanzgruppen. Eingeschlossen ist auch ein Verfahren zur Behandlung von Pflanzen, das sich durch Applikation der Verbindungen der Formel I bzw. der neuen Mittel auszeichnet.

15 Als Zielkulturen für die hierin offenbarten Indikationsgebiete gelten im Rahmen dieser Erfindung z.B. folgende Pflanzenarten: Getriede: (Weizen, Gerste, Roggen, Hafer, Reis, Sorghum und Verwandte); Rüben: (Zucker- und Futterrüben); Kern-, Stein- und Beerenobst: (Äpfel, Birnen, Pflaumen, Pfirsiche, Mandeln, Kirschen, Erd-, Him- und Brombeeren); Hülsenfrüchte: (Bohnen, Linsen, Erbsen, Soja); Oelkulturen: (Raps, Senf, Mohn, Oliven, Sonnenblumen, Kokos, Rizinus, Kakao, Erdnüsse); Gurkengewächse: (Kürbis, Gurken, Melonen); Fasergewächse: (Baumwolle, Flachs, Hanf, Jute); Citrusfrüchte: (Orangen, Zitronen, Grapefruit, Mandarinen); Gemüsesorten: (Spinat, Kopfsalat, Spargel, Kohlarten, Möhren, Zwiebeln, Tomaten, Kartoffeln, Paprika); Lorbeer-gewächse: (Avocado, Cinnamomum, Kampfer) oder Pflanzen wie Mais, Tabak, Nüsse, Kaffee, Zuckerrohr, Tee, Weinreben, Hopfen, Bananen- und Naturkautschukgewächse sowie Zierpflanzen (Blumen, Sträucher, Laubbäume und Nadelbäume wie Koniferen). Diese Aufzählung stellt keine Limitierung dar.

20 25 Wirkstoffe der Formel I werden üblicherweise in Form von Zusammensetzungen verwendet und können gleichzeitig oder nacheinander mit weiteren Wirkstoffen auf die zu behandelnde Fläche oder Pflanze gegeben werden. Diese weiteren Wirkstoffe können sowohl Düngemittel, Spurenelement-Vermittler oder andere das Pflanzenwachstum beeinflussende Präparate sein. Es können aber auch selektive Herbizide, Insektizide, Fungizide, Bakterizide, Nematizide, Molluskizide oder Gemische mehrerer dieser Präparate sein, zusammen mit gegebenenfalls weiteren in der Formulierungstechnik üblichen Trägerstoffen, Tensiden oder anderen applikationsfördernden Zusätzen.

30 35 Geeignete Träger und Zusätze können fest oder flüssig sein und entsprechen den in der Formulierungstechnik zweckdienlichen Stoffen, wie z.B. natürlichen oder regenerierten mineralischen Stoffen, Lösungs-, Dispergier-, Netz-, Haft-, Verdickungs-, Binde-oder Düngemitteln.

40 Ein bevorzugtes Verfahren zum Aufbringen eines Wirkstoffes der Formel I bzw. eines agrochemischen Mittels, das mindestens einen dieser Wirkstoffe enthält, ist das Aufbringen auf das Blattwerk (Blattapplikation). Anzahl der Applikationen und Aufwandmenge richten sich dabei nach dem Befallsdruck für den entsprechenden Erreger (Pilzsorte). Die Wirkstoffe der Formel I können aber auch über den Erdboden durch das Wurzelwerk in die Pflanze gelangen (systemische Wirkung), indem man den Standort der Pflanze mit einer flüssigen Zubereitung tränkt oder die Substanzen in fester Form in den Boden einbringt z.B. in Form von Granulat (Bodenapplikation). Die Verbindungen der Formel I können aber auch auf Samenkörner aufgebracht werden (Coating), indem man die Körner entweder in einer flüssigen Zubereitung des Wirkstoffs tränkt oder sie mit einer festen Zubereitung beschichtet. Darüber hinaus sind in besonderen Fällen weitere Applikationsarten möglich, so z.B. die gezielte Behandlung der Pflanzenstengel oder der Knospen.

45 50 55 Die Verbindungen der Formel I werden dabei in unveränderter Form oder vorzugsweise zusammen mit den in der Formulierungstechnik üblichen Hilfsmitteln eingesetzt und werden daher z.B. zu Emulsionskonzentraten, streichfähigen Pasten, direkt versprühbaren oder verdünnbaren Lösungen, verdünnten Emulsionen, Spritzpulvern, löslichen Pulvern, Stäubemitteln, Granulaten, durch Verkapselungen in z.B. polymeren Stoffen in bekannter Weise verarbeitet. Die Anwendungsverfahren wie Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen, Bestreichen oder Giessen werden gleich wie die Art der Mittel den angestrebten Zielen und den gegebenen Verhältnissen entsprechend gewählt. Günstige Aufwandmengen liegen im allgemeinen bei 50 g bis 5 kg Aktivsubstanz (AS) je ha; bevorzugt 100 g bis 2 kg AS/ha, insbesondere bei 100 g bis 600 g AS/ha.

60 65 Die Formulierungen, d.h. die den Wirkstoff der Formel I und gegebenenfalls einen festen oder flüssigen Zusatzstoff enthaltenden Mittel, Zubereitungen oder Zusammensetzungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch inniges Vermischen und/oder Vermahlen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, wie z.B. mit Lösungsmitteln, festen Trägerstoffen, und gegebenenfalls oberflächenaktiven Verbindungen (Tensiden).

Als Lösungsmittel können in Frage kommen: Aromatische Kohlenwasserstoffe, bevorzugt die Fraktionen C<sub>6</sub> bis C<sub>12</sub>, wie z.B. Xylogemische oder substituierte Naphthaline, Phthalsäureester wie Dibutyl- oder

Diocetylphthalat, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Cyclohexan oder Paraffine, Alkohole und Glykole sowie deren Ether und Ester, wie Ethanol, Ethyenglykol, Ethylenglykolmonomethyl-oder Ethylether, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel wie N-Methyl-2-pyrrolidon, Dimethylsulfoxid oder Dimethylformamid, sowie gegebenenfalls epoxydierte Pflanzenöle wie epoxydiertes Kokosnussöl oder Sojaöl; oder

5 Wasser.

Als feste Trägerstoffe, z.B. für Stäubemittel und dispergierbare Pulver, werden in der Regel natürliche Gesteinsmehle verwendet, wie Calcit, Talcum, Kaolin, Montmorillonit oder Attapulgit. Zur Verbesserung der physikalischen Eigenschaften können auch hochdisperse Kieselsäure oder hochdisperse saugfähige Polymerisate zugesetzt werden. Als gekörnte, adsorptive Granulaträger kommen poröse Typen wie z.B.

10 Bimstein, Ziegelbruch, Sepiolit oder Bentonit, als nicht sorptive Trägermaterialien z.B. Calcit oder Sand in Frage. Darüber hinaus kann eine Vielzahl von vorgranulierten Materialien anorganischer oder organischer Natur wie insbesondere Dolomit oder zerkleinerte Pflanzenrückstände verwendet werden. Besonders vorteilhafte, applikationsfördernde Zuschlagstoffe, die zu einer starken Reduktion der Aufwandmenge führen können, sind ferner natürliche (tierische oder pflanzliche) oder synthetische Phospholipide aus der Reihe

15 der Kephaline und Lecithine, die man beispielsweise aus Sojabohnen gewinnen kann. Verwendbare Handelsmischungen sind z.B. Phosphatidylchlorin-Mischungen. Synthetische Phospholipide sind z.B. Dioc-

tanoylphosphatidylcholin und Dipalmitoylphosphatidylcholin.

Als oberflächenaktive Verbindungen kommen je nach Art des zu formulierenden Wirkstoffes der Formel I nichtionogene, kation-und/oder anionaktive Tenside mit guten Emulgier-, Dispergier- und Netzeigenschaften 20 in Betracht. Unter Tensiden sind auch Tensidgemische zu verstehen.

Geeignete anionische Tenside können sowohl sog. wasserlösliche Seifen, als auch wasserlösliche synthetische oberflächenaktive Verbindungen sein.

Als Seifen seien die Alkali-, Erdalkali-oder gegebenenfalls substituierten Ammoniumsalze von höheren Fettsäuren ( $C_{12}$ - $C_{22}$ ), wie z.B. die Na-oder K-Salze der Oel-oder Stearinsäure, oder von natürlichen 25 Fettsäuregemischen, die z.B. aus Kokosnuss-oder Talgöl gewonnen werden können. Ferner sind auch die Fettsäure-methyllaurinsalze zu erwähnen.

Häufiger werden jedoch sog. synthetische Tenside verwendet, insbesondere Fettalkoholsulfonate, Fettalkoholsulfate, sulfonierte Benzimidazolderivate oder Alkylsulfonate.

Die Fettalkoholsulfonate oder -sulfate liegen in der Regel als Alkali-, Erdalkali-oder gegebenenfalls 30 substituierte Ammoniumsalze vor und weisen einen Alkylrest mit 8 bis 22 C-Atomen auf, wobei Alkyl auch den Alkylteil von Acylresten einschließt, z.B. das Na-oder Ca-Salz der Ligninsulfonsäure, des Dodecyl-

schwefelsäureesters oder eines aus natürlichen Fettsäuren hergestellten Fettalkoholsulfatgemisches. Hierher gehören auch die Salze der Schwefelsäureester und Sulfonsäuren von Fettalkohol-Ethylenoxyd-Addukten. Die sulfonierte Benzimidazolderivate enthalten vorzugsweise 2-Sulfonsäuregruppen und einen 35 Fettsäurerest mit 8-22 C-Atomen. Alkylarylsulfonate sind z.B. die Na-, Ca-oder Triethanolaminsalze der Dodecylbenzolsulfonsäure, der Dibutynaphthalinsulfonsäure, oder eines Naphthalinsulfonsäure-Formaldehydkondensationsproduktes.

Ferner kommen auch entsprechende Phosphate wie z.B. Salze des Phosphorsäureesters eines p-Nonylphenol-(4-14)-Ethylenoxyd-Adduktes in Frage.

40 Als nichtionische Tenside kommen in erster Linie Polyglykoletherderivate von aliphatischen oder cycloaliphatischen Alkoholen, gesättigten oder ungesättigten Fettsäuren und Alkylphenolen in Frage, die 3 bis 30 Glykolethergruppen und 8 bis 20 Kohlenstoffatome im (aliphatischen) Kohlenwasserstoffrest und 6 bis 18 Kohlenstoffatome im Alkylrest der Alkylphenoate enthalten können.

Weitere geeignete nichtionische Tenside sind die wasserlöslichen, 20 bis 250 Aethylenglyk-45 koläthergruppen und 10 bis 100 Propylenglykolethergruppen enthaltenden Polyethylenoxidaddukte an Polypropylenglykol, Aethylendiaminopolypropylenglykol und Alkylpolypropylenglykol mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen in der Alkylkette. Die genannten Verbindungen enthalten üblicherweise pro Propylenglykol-Einheit 1 bis 5 Ethylenglykoleinheiten.

Als Beispiele nichtionischer Tenside seien Nonylphenolpolyethoxyethanole, Ricinusölpolyglykolether, 50 Polypropyl-Polyethylenoxydaddukte, Tributylphenoxypropylmethanol, Polyethylenglykol und Octylphenoxypropylmethanol erwähnt.

Ferner kommen auch Fettsäureester von Polyoxyethylensorbitan wie das Polyoxyethylensorbitan-trioleat in Betracht.

Bei den kationischen Tensiden handelt es sich vor allem um quartäre Ammoniumsalze, welche als N-55 Substituenten mindestens einen Alkylrest mit 8 bis 22 C-Atomen enthalten und als weitere Substituenten niedrige, gegebenenfalls halogenierte Alkyl-, Benzyl- oder niedrige Hydroxyalkylreste aufweisen. Die Salze liegen vorzugsweise als Halogenide, Methylsulfate oder Ethylsulfate vor, z.B. das Stearyltrimethylammoniumchlorid oder das Benzylidi(2-chlorethyl)ethylammoniumbromid.

Die agrochemischen Zubereitungen enthalten in der Regel 0,1 bis 99 Gew.-%, insbesondere 0,1 bis 95 Gew.-%, Wirkstoff der Formel I, 99,9 bis 1 Gew.-% insbesondere 99,8 bis 5 Gew.-%, eines festen oder flüssigen Zusatzstoffes und 0 bis 25 Gew.-%, insbesondere 0,1 bis 25 Gew.-%, eines Tensides.

Während als Handelsware eher konzentrierte Mittel bevorzugt werden, verwendet der Endverbraucher in 5 der Regel verdünnte Mittel.

Die Mittel können auch weitere Zusätze wie Stabilisatoren, Entschäumer, Viskositätsregulatoren, Bindemittel, Haftmittel sowie Dünger oder andere Wirkstoffe zur Erzielung spezieller Effekte enthalten.

Derartige agrochemische Mittel sind ein Bestandteil der vorliegenden Erfindung.

Die folgenden Beispiele dienen zur näheren Erläuterung der Erfindung ohne dieselbe einzuschränken.

10 Temperaturen sind in den Beispielen und den nachfolgenden Tabellen in Centigraden gegeben, die Druckangaben sind in Millibar (mbar).

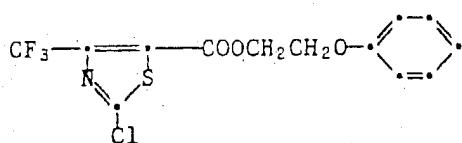
### 1. Herstellungsbeispiele

15

#### Beispiel 1.1

Herstellung von 2-Chlor-5-(2-phenoxyäthyloxycarbonyl)-4-trifluormethyl-thiazol

20



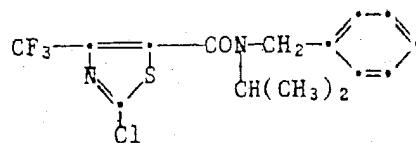
25

Zu einer Lösung von 11 g (0,044 Mol) 2-Chlor-5-chlorcarbonyl-4-trifluormethyl-thiazol in 100 ml absolutem Toluol gibt man unter Rühren 6,3 g (0,045 Mol) 2-Phenoxyethanol. Dann wird die Lösung gekühlt und bei 0 - 5° tropft man unter Rühren 3,6 g (0,045 Mol) Triäthylamin zu. Dabei fällt das Triäthylamin-Hydrochlorid aus. Nachdem alles zugegeben ist, wird die entstandene Suspension während 20 Stunden bei Raumtemperatur weitergerührt und dann auf Eiswasser gegossen. Die organische Phase wird abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und im Rotationsverdampfer eingeengt. Der Rückstand kristallisiert und wird zwecks Reinigung in Petroläther verrührt, abgenutscht und getrocknet. Man erhält so 8,7 g Titelverbindung (57 % der Theorie). Schmelzpunkt 70 - 72°C.

30

#### Beispiel 1.2: Herstellung von 2-Chlor-5-(N-benzyl-N-isopropylamido)-4-trifluormethyl-thiazol

35



40

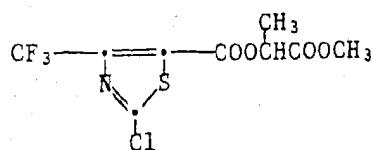
45 Zu einer Lösung von 6,5 g (0,025 Mol) 2-Chlor-3-chlorcarbonyl-4-trifluormethyl-thiazol in 100 ml trockenem Aethylacetat tropft man unter Rühren und Kühlen bei 0 - 5° eine Lösung von 2,8 g (0,027 Mol) Triäthylamin und 4,1 g N-Isopropylbenzylamin (0,027 Mol) in 50 ml Aethylacetat. Nachdem alles zugegeben ist, wird die entstandene gelbe Lösung während 15 Stunden bei Raumtemperatur weitergerührt, dann auf Eiswasser gegossen. Die organische Phase wird abgetrennt über Natriumsulfat getrocknet mit Aktivkohle gereinigt, filtriert und am Rotationsverdampfer eingeengt. Als Rückstand bleibt ein rotbraunes Öl, das zur Reinigung mit Essigester/Hexan über eine Kieselgelsäule chromatographiert wird. Nach Verdampfen des Laufmittels verbleiben 6,5 g Titelprodukt als farbloses analysenreines Öl (73% der Theorie).

50

55

Beispiel 1.3: Herstellung von 2-Chlor 5-(1-methoxycarbonyl-äth-1-yloxy-carbonyl)-4-trifluormethyl-thiazol

5



10 Ein Gemisch, bestehend aus 6.94 g 2-Chlor-5-carboxyl-4-trifluormethyl-thiazol, 5 g 2-Brompro-  
15 pionsäuremethylester und 4.5 g Kaliumcarbonat suspendiert in 50 ml wasserfreiem Dimethylformamid wird  
bei Raumtemperatur während 3 Stunden unter Stickstoffatmosphäre gerührt. Dann wird das Reaktionsgemis-  
sch filtriert und das Filtrat auf Eiswasser/Aethylacetat 1:1 gegossen. Die organische Phase wird abgetrennt,  
3x mit Eis-Wasser gewaschen, getrocknet und am Rota tionsverdampfer eingeengt. Der Rückstand verbleibt  
als farbloses Oel, welches zur Reinigung destilliert wird. 8.5 g Titelprodukt (75 % der Theorie). Kp. 75 -  
80°/0.015 mbar.

Auf analoge Weise werden folgende Verbindungen hergestellt:

20

25

30

35

40

45

50

55

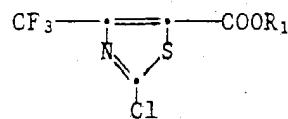


Tabelle 1

No.	R <sup>1</sup>	phys. Konstante
1.001	1-Dodecyl	
1.002	1-Octadecyl	
1.003	Cyclopropylmethyl	
1.004	Cyclopentylmethyl	
1.005	Cyclohexylmethyl	
1.006	Cyclohexylethyl	
1.007	Tetrahydrofuran-2-yl-methyl	
1.008	Pentahydropyran-2-yl-methyl	Smp. 60 - 63°
1.009	2,2-Dimethyl-1,3-dioxolan-4-yl-methyl	$n_{\text{D}}^{20}$ 1.4804
1.010	1,2-Dihydrobenz-1,4-dioxan-2-ylmethyl	Harz
1.011	Furan-2-ylmethyl	
1.012	Thiophen-2-ylmethyl	$n_{\text{D}}^{20}$ 1.5410
1.013	3,4-Methylendioxybenzyl	Smp. 96 - 98°
1.014	Thiophen-2-ethyl	
1.015	5-Methyl-thiazol-4-yläthyl	
1.016	Phenylethyl	
1.017	para Tolyl-eth-1-yl	Oel
1.018	3,45-Trimethoxybenzyl	
1.019	Geranyl	
1.020	2-Hexen-1-yl	
1.021	1-Hexen-6-yl	
1.022	1-Hexen-3-yl	
1.023	2-Chlor-2-propen-1-yl	
1.024	3-Chlor-2-propen-1-yl	
1.025	3-Phenyl-2-propen-1-yl	
1.026	Cyclopentyl	
1.027	Cyclohexyl	
1.028	2-Methyl-cyclohexyl	
1.029	3-Methyl-cyclohexyl	
1.030	4-Methyl-cyclohexyl	
1.031	Cyclododecyl	
1.032	2,3-Dimethyl-cyclohexyl	
1.033	2,4-Dimethyl-cyclohexyl	
1.034	2,6-Dimethyl-cyclohexyl	
1.035	3,5-Dimethyl-cyclohexyl	
1.036	4-Tert.butyl-cyclohexyl	
1.037	Bornyl	Smp. 65 - 67°
1.038	Norbornyl	$n_{\text{D}}^{20}$ 1.5026
1.039	Fenchyl	Oel
1.040	Menthyl	$n_{\text{D}}^{20}$ 1.4860
1.041	2,2-Dichlor-cyclopropylmethyl	
1.042	-CH <sub>2</sub> -CN	
1.043	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN	$n_{\text{D}}^{20}$ 1.4941

No.	R <sup>1</sup>	phys. Konstante
5	1.044 -CH <sub>2</sub> -PO(OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	
	1.045 2-Nitro-ethyl	
	1.046 2-Allyloxy-äthyl	
	1.047 2-Benzylxy-äthyl	
10	1.048 para-Chlorbenzylxyethyl	
	1.049 ortho-Chlorbenzylxyethyl	
	1.050 Cyclopropoxyethyl	
	1.051 Cyclohexyloxyethyl	
	1.052 2-Phenoxy-ethyl	Smp. 70 - 72°
15	1.053 para-Chlorphenoxyethyl	
	1.054 -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -SCH <sub>3</sub>	
	1.055 -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -SO-CH <sub>3</sub>	
	1.056 -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	Smp. 86 - 88°
	1.057 -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -SCH <sub>3</sub>	
20	1.058 -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -SO-CH <sub>3</sub>	
	1.059 -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	
	1.060 -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> (")	
	1.061 -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	
	1.062 Cyclohexylthioethyl	
25	1.063 Benzylthioethyl	
	1.064 para-Chlor-benzylthioethyl	
	1.065 Phenylthioethyl	Smp. 47 - 49°
	1.066 Phenylsulfonylethyl	
	1.067 para-Tolylthioethyl	
30	1.068 para-Chlorphenylthioethyl	
	1.069 Phenylthiopropyl	
	1.070 β-Naphthylthioethyl	
	1.071 2-Phenylthio-1-methyl-ethyl	
	1.072 2-Phenylthio-1-chlormethyl-ethyl	
35	1.073 -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	1.074 -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH(CH <sub>3</sub> )COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	1.075 -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1.076 Piperidinoylthioethyl	
	1.077 -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CS-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
40	1.078 Piperidinothiocarbonylthioethyl	
	1.079 -CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	
	1.080 -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Smp. 80 - 85° / 0.025 mm
	1.081 -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> (n)	
45	1.082 -CH(CH <sub>3</sub> )COOCH <sub>3</sub>	Smp. 25 - 80° / 0.015 mm
	1.083 -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	1.084 -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	1.085 5,5-Dimethyl-tetrahydrofuran-2-on-3-yl	Smp. 100 - 102°
50	1.086 -CH <sub>2</sub> -CO-N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	
	1.087 -CH <sub>2</sub> CON[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub>	
	1.088 -CH <sub>2</sub> CON[CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ] <sub>2</sub>	
	1.089 -CH <sub>2</sub> CON(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	
	1.090 2-Methylpiperidinoylmethyl	
55	1.091 Azepinoylmethyl	n <sup>20</sup> <sub>D</sub> 1.5172

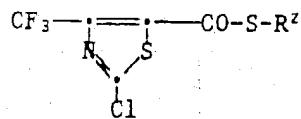
5

No.	R <sup>1</sup>	phys. Konstante
1.092	Anilidomethyl	
1.093	N-Methyl-anilidomethyl	
10 1.094	N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(methoxy-carbonyl-eth-1-yl)-carbamoylmethyl	Smp. 95 - 97°
1.095	1-(Piperidinocarbonyl)-eth-1-yl	Smp. 52 - 66°
1.096	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -NH-CO-CH <sub>3</sub>	
1.097	Cyclopropan-amoyl-ethyl	
15 1.098	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -NH-CO-CH <sub>2</sub> -Cl	
1.099	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -NH-CO-CHCl <sub>2</sub>	
1.100	Benzamoyl-ethyl	
1.101	Thienyl-2-carbamoylethyl	
1.102	Furfuramoylethyl	
20 1.103	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -NH-CO-NH-CH <sub>3</sub>	
1.104	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	
1.105	Phenylureylene-ethyl	
1.106	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )COCH <sub>3</sub>	
1.107	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )COCHCl <sub>2</sub>	
25 1.108	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CONHCH <sub>3</sub>	
1.109	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> )SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
1.110	N-Methyl-phenylsulfamoyl-ethyl	
1.111	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i)COCHCl <sub>2</sub>	
1.112	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH=OH <sub>2</sub> )CONHCl <sub>2</sub>	
30 1.113	2-Oxo-pyrrolidino-ethyl	Smp. 58 - 62°
1.114	Dicyclohexylmethyl	
1.115	α-Phenylbenzyl	n <sub>D</sub> <sup>20</sup> 1,5695
1.116	α-Methylbenzyl	
35 1.117	α-Carboxylbenzyl	
1.118	α-Carboxyl-para-chlorbenzyl	
1.119	α-Methoxycarbonyl-benzyl	Smp. 62 - 64°
1.120	α-Ethoxycarbonyl-benzyl	
1.121	α-Cyanobenzyl	Smp. 78 - 81°
1.122	α-Benzoyl-benzyl	Smp. 105 - 109°
40 1.123	α-Methoxycarbonyl-α-phenylbenzyl	Smp. 106 - 110°
1.124	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1.125	Pyrrolidinoethyl	
1.126	Piperidinoethyl	
1.127	Morpholinoethyl	Smp. 185 - 187° (Hydrochlorid)
45 1.128	Anilinoethyl	
1.129	para (1-Methoxycarbonyl)ethoxyphenyl	
1.130	para(3-Methyl-1,3-oxazolidin-2-yl)phenyl	
1.131	para(N'N'-(Dimethyl-ureylene)-phenyl	
50 1.132	meta(N',N'-Dimethyl-ureylene)phenyl	
1.133	β-Cyano-β-Methoxycarbonyl-styryl-4-yl	
1.134	β,β-Di(Methoxycarbonyl)-styryl-4-yl	
1.135	β,β-Dicyano-styryl-4-yl	

55

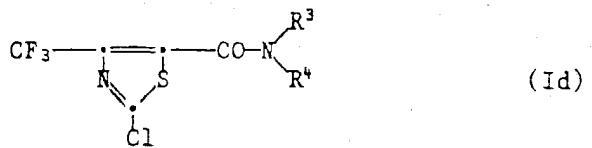
5	Nr.	R <sup>1</sup>	phys. Konstante
	1.136	-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	1.137	-COOH	Smp. 59 - 60°
	1.138	-COO Benzyl	Smp. 122 - 125°
10	1.139	-COO(4,4-Dimethyl-tetrahydro-fur-3-yl-2-on)	Smp. 56 - 58°
	1.140	-COO(4-Methyl-thiazol-5-ylethyl)	Smp. 100 - 102°
	1.141	-COO(2,3,5,6-Diepoxy-cyclohexan-1-yl)	Smp. 64 - 67°
15	1.142	-COO(2,3,5,6-Diepoxy-cyclohexan-1-yl)	syn. isomer Smp. 144 - 175°
	1.143	$\alpha$ -(4-Chlorphenyl)benzyl	anti isomer Smp. 144 - 120°
	1.144	$\alpha$ -(2-Chlorphenyl)benzyl	
	1.145	$\alpha$ -(4-Chlorphenyl)-4-chlorbenzyl	
20	1.146	$\alpha$ -(2-Chlorphenyl)-2-chlorbenzyl	
	1.147	$\alpha$ -(2-Chlorphenyl)-4-chlorbenzyl	
	1.148	$\alpha$ -(4-Fluorophenyl)-benzyl	
	1.149	$\alpha$ -(2-Fluorophenyl)-benzyl	
	1.150	$\alpha$ -(4-Fluorophenyl)-4-fluorobenzyl	
25	1.151	$\alpha$ -(2-Fluorophenyl)-2-fluorobenzyl	
	1.152	$\alpha$ -(2-Fluorophenyl)-4-fluorobenzyl	
	1.153	$\alpha$ -(4-Tolyl)-benzyl	
	1.154	$\alpha$ -(4-Anisyl)-benzyl	
	1.155	$\alpha$ -(4-Methoxyphenyl)-benzyl	
30	1.156	$\alpha$ -(3-Trifluorophenyl)-benzyl	

35 Tabelle 2



40	Nr.	R <sup>2</sup>	Physikal. Daten
	2.001	-CH <sub>2</sub> -COOH	
	2.002	-CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	
	2.003	-CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
45	2.004	-CH(CH <sub>3</sub> )COOH	
	2.005	CH(CH <sub>3</sub> )COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	2.006	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -COOH	
	2.007	-CH <sub>2</sub> -CO-N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	
	2.008	Piperidinamoylmethyl	
50	2.009	Azepinamoylmethyl	
	2.010	Anilidomethyl	
	2.011	para Chloranilidmethyl	
	2.012	2-Carboxyphenylmethyl	
	2.013	Benzyl	Smp. 64 - 66°
55			

Tabelle 3



	Nr.	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Physikal. Daten
10	3.001	Allyl	Allyl	Smp. 38 - 40°
	3.002	Allyl	2-Methoxy-äethyl	
	3.003	Allyl	Isopropyl	
15	3.004	2-Methyl-2-propen-1-yl	Isopropyl	
	3.005	2-Methyl-2-propen-1-yl	Cyclohexyl	
	3.006	2-Chlor-2-propen-1-yl	2-Methoxy-äethyl	
	3.007	2-Chlor-2-propen-1-yl	Isopropyl	
20	3.008	2-Chlor-2-propen-1-yl	Cyclohexyl	Smp. 70 - 72°
	3.009	2-Chlor-2-propen-1-yl	2-Chlor-2-propen-1-yl	Smp. 38 - 40°
25	3.010	3-Chlor-2-propen-1-yl	Propyl	
	3.011	Propyl	2-Methoxy-äethyl	
	3.012	Methyl	Cyclohexyl	
	3.013	Methyl	Benzyl	n <sub>D</sub> <sup>20</sup> 1.5408
30	3.014	Methyl	2,6-Dichlor-benzyl	Smp. 118 - 120°
	3.015	Isopropyl	Benzyl	n <sub>D</sub> <sup>20</sup> 1.5333
	3.016	Isopropyl	4-Chlor-benzyl	
	3.017	H	Benzyl	Smp. 102-105°
35	3.018	H	Phenyl	
	3.019	Methyl	Phenyl	Smp. 57 - 59°
	3.020	Methyl	4-Chlor-phenyl	
	3.021	Ethyl	2-Chlor-4-brom-phenyl	
	3.022	Ethyl	3-Trifluormethyl-phenyl	
40	3.023	H	-CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	3.024	Methyl	-CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	
	3.025	Isopropyl	-CH <sub>2</sub> -CO-NH-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (i)	
	3.026	Cyclopropyl	-CH <sub>2</sub> -CO-N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	
45	3.027	Ethyl	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN	
	3.028	Allyl	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN	
	3.029	Cyclohexyl	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN	
	3.030	Phenyl	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN	
	3.031	Phenyl	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -COOH	
50	3.032	Cyclohexyl	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	Smp. 116 - 120°
	3.033	2,6-Dimethyl-phenyl	-CH(CH <sub>3</sub> )COOCH <sub>3</sub>	Smp. 120 - 123°
	3.034	Phenyl	-CH <sub>2</sub> -COOH	
	3.035	Phenyl	-CH <sub>2</sub> -CN	
	3.036	4-Chlor-phenyl	-CH <sub>2</sub> -CN	
	3.037	2,4-Dichlor-phenyl	-CH <sub>2</sub> -CN	
55	3.038	3,4-Dichlor-phenyl	-CH <sub>2</sub> -CN	Smp. 128 - 131°
	3.039	3-Trifluormethyl-phenyl	-CH <sub>2</sub> -CN	
	3.040	Methyl	1-Cyanocyclopent-1-yl	Smp. 130 - 133°
	3.041	H	3-Trifluoromethyl-cyclohexyl	
	3.042	H	-NH <sub>2</sub>	
	3.043	H	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	3.044	Methyl	-NH-CH <sub>3</sub>	

Nr.	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Physikal. Daten
5	3.045 H	Anilino	Smp. 137 - 138°
	3.046 H	2-Benzoyl-hydrazo	
	3.047 H	2-Phenylsulfonyl-hydrazo	
10	3.048 Pyrrolidino		
	3.049 Piperidino		
	3.050 2-Methylpiperidino		
	3.051 2-Ethylpiperidino		
	3.052 Hexahydroazepino		
	3.053 Morpholino		
15	3.054 2,2,5,5-Tetramethyl 1,3-oxazolidin-3-yl		
	3.055 5,5-Dimethyl-2,2-tetra-methylen-1,3-oxazolidin-3-yl		
	3.056 5,5-Dimethyl-2,2-pentamethylen-1,3-oxazolidin-3-yl		
	3.057 2-Phenyl-1,3-oxazolidin-3-yl		
	3.058 2,2-Tetramethylen-benzthiazol-3-yl		
20	3.059 2-Oxo-pyrrolidino		
	3.060 Hexahydro-2-oxo-azepino		
	3.061 3-Oxo-thiomorpholino		
	3.062 2-Oxo-1,3-oxazolin-3-yl		
	3.063 2-Trichloromethyl-1,3-oxazolidin-3-yl		
25	3.064 H	2-Chlorbenzyl	
	3.065 H	2-Hexylbenzyl	
	3.066 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Smp. 40 - 41°
	3.067 Allyl	H	Smp. 56 - 58°
	3.068 Phenylethyl	H	Smp. 88 - 84°
30	3.069 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,6-Dichlorbenzyl	Smp. 89 - 91°
	3.070 2-Chlorbenzyl	H	Smp. 115 - 116°
	3.071 Allyl	Allyl	Smp. 100 - 101°
	3.072 C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -n	2,6-Dichlorbenzyl	n <sub>D</sub> <sup>20</sup> 1.5491
	3.073 Allyl	Ethoxycroton-2-yl	Smp. 72 - 74°
35	3.074 CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-Chlorallyl	n <sub>D</sub> <sup>20</sup> 1.5027
	3.075 4-Chlor-2-fluor-6-iso-propoxyphenyl	H	Smp. 123 - 125°
	3.076 Cyano-dimethylmethyl	Methoxyethyl	Smp. 130 - 132°
40	3.077 Chlorphenyl	H	Smp. 125 - 128°
	3.078 Cyano-dimethyl-methyl	H	Smp. 78 - 80°
	3.079 2,2-Dimethylindanyl	H	Smp. 174 - 175°
	3.080 3,5-Bistrifluormethyl-phenyl	H	Smp. 125 - 127°
45	3.081 Diphenylmethyl	H	Smp. 177 - 179°
	3.082 2,6-Difluorophenyl	H	Smp. 160 - 161°
	3.083 5-Trifluormethyl-thiazol-2-yl	H	Smp. 136 - 138°
	3.084 2-Carboxyl-4-chlorphenyl	H	Smp. 132 - 134°
50	3.085 3-Trifluormethylcyclo-hexyl	H	Smp. 106 - 109°
	3.086 2,4,6-Trichloranilino	H	Smp. 184 - 186°
	3.087 Furfuryl	H	Smp. 100 - 102°
	3.088 3,4-Methylendioxybenzyl	H	Smp. 129 - 131°
55	3.089 4-Amidosulfonylphenyl	H	Smp. 186 - 189°
	3.090 1,2-Diphenyleth-1-yl	H	Smp. 146 - 148°

Nr.	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Physikal. Daten
5	3.091 α-Methylbenzyl	H	Smp. 131 - 133°
	3.092 Benzoylamido	H	Smp. 192 - 194°
	3.093 4-Fluorbenzyl	H	Smp. 128 - 130°
	3.094 2,2-Diphenyleth-1-yl	H	Smp. 127 - 129°
10	3.095 1-Cyano-cyclopent-1-yl	Methoxycarbonylmethyl	Smp. 145 - 147°
	3.096 1-Cyano-cyclohex-1-yl	H	Smp. 145 - 147°
	3.097 2-Methoxycarbonyl-4-chlorphenyl	H	
	3.098 2-Methylaminocarbonyl-4-chlorphenyl	H	
15	3.099 2-Dimethylamino	H	
	3.100 Anilino	H	
	3.101 2-Chloranilino	H	
	3.102 4-Chloranilino	H	
	3.103 1-Cyanocyclopent-1-yl	CH <sub>3</sub>	

## 2. Formulierungsbeispiele für feste Wirkstoffe der Formel I

% = Gewichtsprozent

25

## 2.1 Spritzpulver

	a)	b)	c)
Wirkstoff aus den Tabellen 1 - 3	25 %	50 %	75 %
Na-Ligninsulfonat	5 %	5 %	
Na-Laurylsulfat	3 %	-	5 %
Na-Diisobutylnaphthalinsulfonat	-	6 %	10 %
Octylphenolpolyethyleneglykolether (7-8 Mol Ethylenoxid)	-	2 %	-
Hochdisperse Kieselsäure	5 %	10 %	10 %
Kaolin	62 %	27 %	-

40

Der Wirkstoff wird mit den Zusatzstoffen gut vermischt und in einer geeigneten Mühle gut vermahlen. Man erhält Spritzpulver, die sich mit Wasser zu Suspensionen jeder gewünschten Konzentration verdünnen lassen.

45

## 2.2 Emulsions-Konzentrat Wirkstoff aus den Tabellen 1 - 3 10 %

Ocrylphenolpolyethyleneglykolether (4-5 Mol Ethylenoxid)	3 %
Ca-Dodecylbenzoisulfonat	3 %
Ricinusölpolyglykolether (35 Mol Ethylenoxid)	4 %
Cyclohexanon	30 %
Xylogemisch	50 %

55 Aus diesem Konzentrat können durch Verdünnen mit Wasser Emulsionen jeder gewünschten Konzentration hergestellt werden.

2.3 Stäubemittel

	a)	b)
Wirkstoff aus den Tabellen 1 - 3	5 %	8 %
Talkum	95 %	-
Kaolin	-	92 %

Man erhält anwendungsfertige Stäubemittel, indem der Wirkstoff mit dem Träger vermischt und auf einer geeigneten Mühle vermahlen wird.

10

2.4 Extruder Granulat Wirkstoff aus den Tabellen 1 - 3 10 %

Na-Ligninsulfonat	2 %
Carboxymethylcellulose	1 %
Kaolin	87 %

Der Wirkstoff wird mit den Zusatzstoffen vermischt, vermahlen und mit Wasser angefeuchtet. Dieses Gemisch wird extrudiert und anschliessend im Luftstrom getrocknet.

20

2.5 Umhüllungs-Granulat Wirkstoff aus den Tabellen 1 - 3 3%

Polyethylenglykol (MG 200)	3 %
Kaolin	94 %

(MG = Molekulargewicht)

Der fein gemahlene Wirkstoff wird in einem Mischer auf das mit Polyethylenglykol angefeuchtete Kaolin gleichmässig aufgetragen. Auf diese Weise erhält man staubfreie Umhüllungs-Granulate.

30

2.6 Suspensions-Konzentrat Wirkstoff aus den Tabellen 1 - 3 40 %

Ethylenglykol	10 %
Nonylphenolpolyethylenglykolether (15 Mol Ethylenoxid)	6 %
N-Ligninsulfonat	10 %
Carboxymethylcellulose	1 %
37%ige wässrige Formaldehyd-Lösung	0,2 %
Silikonöl in Form einer 75%igen wässrigen Emulsion	0,8 %
Wasser	32 %

Der fein gemahlene Wirkstoff wird mit den Zusatzstoffen innig vermischt. Man erhält so ein Suspensions-Konzentrat, aus welchem durch Verdünnen mit Wasser Suspensionen jeder gewünschten Konzentration hergestellt werden können.

45

3. Biologische Beispiele:Beispiel 3.1: Wirkung gegen Puccinia graminis auf Weizen

50

a) Residual-protective Wirkung

Weizenpflanzen werden 6 Tage nach der Aussaat mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,006 % Aktivsubstanz) besprüht. Nach 24 Stunden werden die behandelten Pflanzen mit einer Uredosporensuspension des Pilzes infiziert. Nach einer Inkubation während 48 Stunden bei 95 - 100 % relativer Luftfeuchtigkeit und ca. 20°C werden die infizierten Pflanzen in einem Gewächshaus bei ca. 22°C aufgestellt. Die Beurteilung der Rostpustelnentwicklung erfolgt 12 Tage nach der Infektion.

b) Systemische Wirkung

Zu Weizenpflanzen wird 5 Tage nach der Aussaat eine aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellte Spritzbrühe gegossen (0.002 % Aktivsubstanz bezogen auf das Bodenvolumen). Nach 48 Stunden werden die behandelten Pflanzen mit einer Uredosporensuspension des Pilzes infiziert. Nach einer Inkubation während 48 Stunden bei 95 - 100 % relativer Luftfeuchtigkeit und ca. 20°C werden die infizierten Pflanzen in einem Gewächshaus bei ca. 22°C aufgestellt. Die Beurteilung der Rostpustelnentwicklung erfolgt 12 Tage nach der Infektion.

Die geprüften Verbindungen aus den Tabellen 1 - 3 insbesondere 3.040 zeigen gegen Puccinia-Pilze gute Wirksamkeit. Sie verhindern den Puccinia-Befall fast vollständig (Befall = 0 - 10 %). Unbehandelte aber infizierte Kontrollpflanzen weisen dagegen einen Puccinia-Befall von 100 % auf.

Beispiel 3.2: Wirkung gegen Cercospora arachidicola auf Erdnusspflanzen

15      Residual-protective Wirkung

10 - 15 cm hohe Erdnusspflanzen werden mit einer aus Spritzpulver der Wirksubstanz hergestellten Spritzbrühe (0,02 % Aktivsubstanz) besprüht und 48 Stunden später mit einer Konidiensuspension des Pilzes infiziert. Die infizierten Pflanzen werden während 72 Stunden bei ca. 21°C und hoher Luftfeuchtigkeit inkubiert und anschliessend bis zum Auftreten der typischen Blattflecken in einem Gewächshaus aufgestellt. Die Beurteilung der fungiziden Wirkung erfolgt 12 Tage nach der Infektion basierend auf Anzahl und Grösse der auftretenden Flecken.

Im Vergleich zu unbehandelten, aber infizierten Kontrollpflanzen (Anzahl und Grösse der Flecken = 100 %), zeigten Erdnusspflanzen, die mit Wirkstoffen aus den Tabellen 1 - 3 behandelt wurden, einen stark reduzierten Cercospora-Befall. Mit einzelnen Verbindungen konnte das Auftreten von Flecken fast vollständig verhindert werden (Befall = 0 - 10 %). Sehr gute Wirkung wurde mit Verbindung 1.009 erreicht.

30      Beispiel 3.3: Wirkung gegen Erysiphe graminis auf Gerste

a) Residual-protective Wirkung

Ca. 8 cm hohe Gerstenpflanzen werden mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,02 % Aktivsubstanz) besprüht. Nach 3-4 Stunden werden die behandelten Pflanzen mit Konidien des Pilzes bestäubt. Die infizierten Gerstenpflanzen werden in einem Gewächshaus bei ca. 22°C aufgestellt und der Pilzbefall nach 10 Tagen beurteilt.

40      b) Systemische Wirkung

Zu ca. 8 cm hohen Gerstenpflanzen wird eine aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellte Spritzbrühe gegossen (0,005 % Aktivsubstanz bezogen auf das Erdvolumen). Es wurde dabei darauf geachtet, dass die Spritzbrühe nicht mit den oberirdischen Pflanzenteilen in Berührung kam. Nach 48 Stunden werden die behandelten Pflanzen mit Konidien des Pilzes bestäubt. Die infizierten Gerstenpflanzen werden in einem Gewächshaus bei ca. 22°C aufgestellt und der Pilzbefall nach 10 Tagen beurteilt.

Verbindungen aus den Tabellen 1 - 3 besonders 1.009, 1.012, 1.065, 1.115, 1.127, 1.137, 3.077, 3.084 und 3.086 zeigen gute Wirksamkeit gegen Erysiphe-Pilze. Unbehandelte jedoch infizierte Kontrollpflanzen weisen dagegen einen Erysiphe-Befall von 100 % auf.

50

Beispiel 3.4: Residual-protective Wirkung gegen Venturia inaequalis auf Apfeltrieben

Apfelstecklinge mit 10-20 cm langen Frischtrieben werden mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,06 % Aktivsubstanz) besprüht. Nach 24 Stunden werden die behandelten Pflanzen mit einer Konidiensuspension des Pilzes infiziert. Die Pflanzen werden dann während 5 Tagen bei

90 - 100 % relative Luftfeuchtigkeit inkubiert und während 10 weiteren Tagen in einem Gewächshaus bei 20 - 24°C aufgestellt. Der Schorfbefall wird 15 Tage nach der Infektion beurteilt. Verbindungen aus den Tabellen 1 - 3 zeigen gute Wirksamkeit gegen Venturia. Unbehandelte jedoch infizierte Triebe weisen dagegen einen 100%igen Venturia-Befall auf.

5

Beispiel 3.5: Wirkung gegen Botrytis cinerea auf Bohnen

Residual protektive Wirkung

10

Ca. 10 cm hohe Bohnen-Pflanzen werden mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,02 % Aktivsubstanz) besprüht. Nach 48 Stunden werden die behandelten Pflanzen mit einer Konidiensuspension des Pilzes infiziert. Nach einer Inkubation der infizierten Pflanzen während 3 Tagen bei 95-100 % relativer Luftfeuchtigkeit und 21°C erfolgt die Beurteilung des Pilzbefalls. Verbindungen aus den Tabellen 1 - 3 hemmen die Pilzinfektion sehr stark. Unbehandelte jedoch infizierte Kontrollpflanzen weisen dagegen einen Botrytis-Befall von 100 % auf. Sehr gut wirkten die Verbindungen 1.009, 1.012, 1.065, 1.115, 1.127, 1.137, 3.077, 3.084 und 3.086.

15

20 Beispiel 3.6: Wirkung gegen Pyricularia oryzae auf Reispflanzen

a) Residual-protektive Wirkung

Reispflanzen werden nach zweiwöchiger Anzucht mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,02 % Aktivsubstanz) besprüht. Nach 48 Stunden werden die behandelten Pflanzen mit einer Konidiensuspension des Pilzes infiziert. Nach 5 Tagen Inkubation bei 95-100 % relativer Luftfeuchtigkeit und 24°C wird der Pilzbefall beurteilt.

30

b) Systemische Wirkung

Zu zwei Wochen alten in für Blumen üblichen Tontöpfen wachsenden Reispflanzen wird eine aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellte Spritzbrühe gegossen (0,006 % Aktivsubstanz bezogen auf das Erdvolumen). Darauf werden die Töpfe mit Wasser soweit gefüllt, dass die untersten Stengelteile der Reispflanzen im Wasser stehen. Nach 48 Stunden werden die behandelten Reispflanzen mit einer Konidiensuspension des Pilzes infiziert. Nach einer Inkubation der infizierten Pflanzen während 5 Tagen bei 95-100 % relativer Luftfeuchtigkeit und ca. 24° wird der Pilzbefall beurteilt.

Verbindungen aus den Tabellen zeigen gute Wirksamkeit gegen den Pyriculariapilz. Unbehandelte, jedoch infizierte Kontrollpflanzen weisen dagegen einen Pyricularia-Befall von 100 % auf. So hemmen die Verbindungen der Tabellen 1 - 3 insbesondere 1.115 und 3.040 den Pilzbefall bis auf 0 bis 5 %.

Beispiel 3.7: Wirkung gegen Tilletia caries an Weizen

45 Künstlich mit Brandsporen von Tilletia caries infizierte Wintergerste der Sorte Porbus (3 g trockenes Sporenmaterial auf 1 kg Saatgut) wird auf einer Mischrolle mit dem zu prüfenden Fungizid gebeizt, wobei eine Konzentration von 60 ppm AS (bezogen auf das Gewicht des Saatgutes) zur Anwendung gelangt.

Der infizierte und behandelte Weizen wird im Oktober im Freiland mittels einer Sämaschine auf Parzellen von 2 m Länge und 3 Saatreihen mit dreifacher Wiederholung ausgesät.

50 Zur Ermittlung der Wirkstoffaktivität werden zum Zeitpunkt der Aehrenreife der prozentuale Anteil Tilletia-befallener Aehren ausgezählt.

Verbindungen aus den Tabellen zeigen gute Wirksamkeit gegen Tilletia. Unbehandelte jedoch infizierte Kontrollpflanzen weisen dagegen einen Tilletia-Befall von 100 % auf. So hemmen die Verbindungen der Tabellen 1 - 3 den Pilzbefall bis auf 0 bis 5 %.

55

Beispiel 3.8: Wirkung gegen *Helminthosporium gramineum* an Gerste

Auf natürliche Weise mit *Helminthosporium gramineum* infizierte Wintergerste der Sorte "CI" wird auf einer Mischrolie mit dem zu prüfenden Fungizid gebeizt, wobei eine Konzentration von 60 ppm AS (bezogen auf das Gewicht des Saatgutes) zur Anwendung gelangt.

Die infizierte und behandelte Gerste wird im Oktober im Freiland mittels einer Sämaschine auf Parzellen von 2 m Länge und 3 Saatreihen mit dreifacher Wiederholung ausgesät.

Bis zur Befallsauswertung wird die Versuchspflanzung unter normalen Feldbedingungen kultiviert.

Zur Ermittlung der Wirkstoffaktivität werden zum Zeitpunkt des Aehrenschiebens der prozentuale Anteil

10 *Helminthosporium*-befallener Halme ausgezählt.

Die Verbindungen der Tabellen 1 - 3 zeigen gute Wirksamkeit gegen *Helminthosporium*. Sie hemmen den Pilzbefall bis auf 0 - 5 % während unbehandelte infizierte Kontrollpflanzen einen *Helminthosporium*-Befall von 100 % aufweisen.

15

Beispiel 3.9: Wirkung gegen *Phytophthora* auf Tomatenpflanzena) Residual-protective Wirkung

20

Tomatenpflanzen wurden nach 3-wöchiger Anzucht mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,006 % Aktivsubstanz) besprüht. Nach 24 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporangiensuspension des Pilzes infiziert. Die Beurteilung des Pilzbefalls erfolgte nach einer Inkubation der infizierten Pflanzen während 5 Tagen bei 90-100 % relativer Luftfeuchtigkeit und 20°C.

25

b) Residual-kurative Wirkung

30

Tomatenpflanzen wurden nach 3-wöchiger Anzucht mit einer Sporangien suspension des Pilzes infiziert. Nach einer Inkubation von 22 Stunden in einer Feuchtkammer bei 90-100 % relativer Luftfeuchtigkeit und 20°C wurden die infizierten pflanzen getrocknet und mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,006 % Aktivsubstanz) besprüht. Nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die behandelten Pflanzen wieder in die Feuchtkammer gebracht. Die Beurteilung des Pilzbefalls erfolgte 5 Tage nach der Infektion.

35

c) Systemische Wirkung

40

Zu Tomatenpflanzen wurde nach 3-wöchiger Anzucht eine aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellte Spritzbrühe gegossen (0,002 % Aktivsubstanz bezogen auf das Erdvolumen). Es wurde dabei darauf geachtet, dass die Spritzbrühe nicht mit den oberirdischen Pflanzenteilen in Berührung kam. Nach 48 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporangiensuspension des Pilzes infiziert. Die Beurteilung des Pilzbefalls erfolgte nach einer Inkubation der infizierten Pflanzen während 5 Tagen bei 90-100 % relativer Luftfeuchtigkeit und 20°C.

45

Verbindungen aus Tabellen 1 - 3 zeigen gegen *Phytophthora* gute Wirksamkeit. So reduzieren z.B. die Verbindungen 1.009, 1.043, 1.052, 1.115, 1.127 und 3.040 den *Phytophthora*-Befall bis auf 5-20 %. Unbehandelte aber infizierte Kontrollpflanzen weisen dagegen einen *Phytophthora*-Befall von 100 % auf.

Beispiel 3.10: Wirkung gegen *Rhizoctonia solani* (Bodenpilz auf Reispflanzen)

50

a) Protektiv-lokale Bodenapplikation

55

12 Tage alte Reispflanzen werden mit einer aus einer Formulierung des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,006 % Aktivsubstanz), ohne oberirdische Pflanzenteile zu kontaminiieren, angegossen. Zur Infizierung der behandelten Pflanzen wird eine Suspension von Myzel und Sklerotien von *R. solani* auf die Bodenoberfläche gegeben. Nach 6-tägiger Inkubation bei 27°C (Tag), bzw. 23°C (Nacht) und 100 % rel. Luftfeuchtigkeit (Feuchtkasten) in der Klimakkamer wird der Pilzbefall auf Blattscheide, Blättern und Stengel beurteilt.

b) Protektiv-lokale Blattapplikation

12 Tage alte Reispflanzen werden mit einer aus einer Formulierung der Wirkstoffe hergestellten Spritzbrühe besprüht. Ein Tag später werden die behandelten Pflanzen mit einer Suspension von Myzel und Sklerotien von *R. solani* infiziert. Nach 6-tägiger Inkubation bei 27°C (Tag), bzw. 23°C (Nacht) und 100 % rel. Luftfeuchtigkeit (Feuchtkasten) in der Klimakammer wird der Pilzbefall auf Blattscheide, Blättern und Stengel beurteilt.

Die geprüften Verbindungen der Tabellen 1 - 3 zeigten in diesem Versuch gute Wirkung. Am ausgeprägtesten war diejenige der Verbindung 3.040.

10

Beispiel 3.11: Wirkung gegen *Xanthomonas oryzae* auf Reis (*Oryza sativa*)

#### a) Residual-protective Wirkung

15

Reispflanzen der Sorte "Calora" oder "S6" werden nach 3-wöchiger Anzucht im Gewächshaus mit der Prüfsubstanz in Form einer Spritzbrühe (0,02 % Aktivsubstanz) besprührt. Nach eintägigem Antrocknen dieses Spritzbelags werden die Pflanzen in einem Klimaraum bei 24°C und 75-85 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt und infiziert. Die Infektion erfolgt, indem die Blattspitzen mit einer Schere, die zuvor in eine Suspension von *Xanthomonas oryzae* eingetaucht worden war, abgeschnitten werden. Nach 20-tägiger Inkubation werden die angeschnittenen Blätter bei Befall weich, rollen sich ein und werden nekrotisch. Das Ausmass dieser Krankheitssymptome dient zur Beurteilung der residual Wirksamkeit der Prüfsubstanz.

## 25 b) Systemische Wirkung

Reispflanzen der Sorte "Calora" oder "S6" werden nach 3-wöchiger Anzucht im Gewächshaus mit einer Suspension der Prüfsubstanz begossen (0,006 % Aktivsubstanz bezogen auf das Erdvolumen). Drei Tage nach dieser Behandlung werden die Pflanzen in einem Klimaraum bei 24°C und 75-85 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt und infiziert. Die Infektion erfolgt, indem die Blattspitzen mit einer Schere, die zuvor in eine Suspension von *Xanthomonas oryzae* eingetaucht worden war, abgeschnitten werden. Nach 10-tägiger Inkubation werden die angeschnittenen Blätter bei Befall welk, rollen sich ein und werden nekrotisch. Das Ausmass dieser Krankheitssymptome dient zur Beurteilung der systemischen Wirksamkeit der Prüfsubstanz.

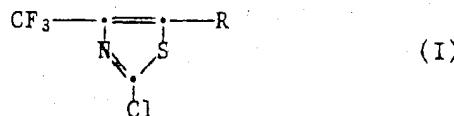
35 Die geprüften Verbindungen aus den Tabellen 1 und 3 zeigten eine gute Wirkung gegen *Xanthomonas oryzae*. So reduzierten z.B. im Test (a) und im Test (b) die Verbindungen 1.127 und 1.137 Pilzbefall auf 0 bis 20 %. Unbehandelte jedoch infizierte Kontrollpflanzen wiesen dagegen einen Krankheitsbefall von 100 % auf.

40

### **Ansprüche**

1. Fungizides Mittel dadurch gekennzeichnet, dass es neben inerten Zutaten und einem Tensid als Wirkstoff ein 2-Chlor-4-trifluormethylthiazol-Derivat der Formel I enthält:

45



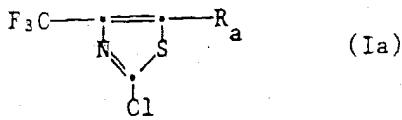
2

worin

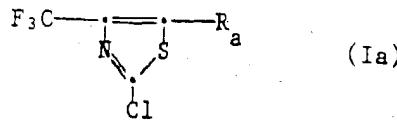
R einen organischen Rest mit maximal 40 Kohlenstoffatomen bedeutet, der gegebenenfalls auch Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel enthalten kann und der sich durch Hydrolyse und/oder Oxydation in eine an den Thiazolring gebundene Carboxylgruppe verwandeln lässt.

2. Fungizides Mittel gemäss Anspruch 1 der Formel I, worin R einen organischen Rest mit maximal 25 Kohlenstoffatomen bedeutet.

### 3. Fungizides Mittel gemäss Anspruch 1 der Formel 1a



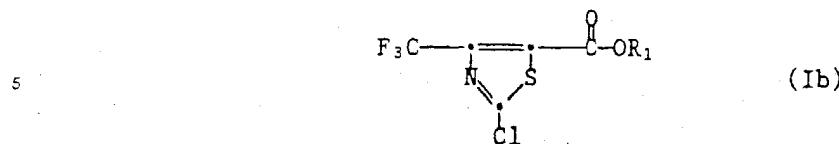
- 5           worin R<sub>1</sub> einen Rest Cyan, -COXR<sub>1</sub>, -CONR<sub>2</sub>R<sub>3</sub> oder -CO-D,  
 X Sauerstoff oder Schwefel,  
 R<sub>2</sub> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub> Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder substituiert durch Halogen,  
 10       eine Gruppe -YR<sub>2</sub>, A, Nitro, -N(R<sub>3</sub>)COA, -[N(R<sub>3</sub>)]<sub>m</sub>-C(A)=NC<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> alkyl, -[N(R<sub>3</sub>)]<sub>m</sub>-C(A)=NH oder -[N(R<sub>3</sub>)]<sub>m</sub>-CO-N[(CO)<sub>m</sub>R<sub>3</sub>], -[N(R<sub>3</sub>)]<sub>m</sub>-CON[(CO)<sub>m</sub>-R3]-N(R<sub>3</sub>)<sub>m</sub>-(CO)<sub>m</sub>R<sub>4</sub>, in welchem Rest einer der Indices m Null sein muss, ferner kann der C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkyl-oder C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub> Cycloalkylrest substituiert sein durch Cyano, einen Rest -C(X)<sub>m</sub>-XR<sub>5</sub>, -XCXR<sub>6</sub>, -(X)<sub>m</sub>-CXA, -(X)CXN(R<sub>3</sub>)(N(R<sub>3</sub>)R<sub>4</sub>), -CHA-COOR<sub>10</sub>, -C(OR<sub>1</sub>)(OR<sub>2</sub>)R<sub>6</sub>, -PO(R<sub>3</sub>)R<sub>6</sub>, C<sub>3</sub>-C<sub>n</sub> Cycloalkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>n</sub> Cycloalkenyl; R<sub>4</sub> ist ferner C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkenyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub> Cycloalkenyl, welches unsubstituiert oder substituiert ist durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Halogenalkyl oder einen Rest -CO(O)<sub>m</sub>-R<sub>10</sub>, -COA, -CON(A)R<sub>1</sub>, oder -PO(R<sub>3</sub>)R<sub>6</sub>; R<sub>5</sub> ist ferner C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkinyl, welches unsubstituiert ist oder ein Rest -(E)<sub>m</sub>U oder -(E)<sub>m</sub>Q;
- 15       R<sub>6</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub> Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkoxyalkoxy, Halogen, Cyan oder einen Rest -CX(X)<sub>m</sub>R<sub>10</sub>, -(X)<sub>m</sub>-CX-A, -(X)<sub>m</sub>CXR<sub>10</sub>, N(R<sub>3</sub>)COA, -[N(R<sub>3</sub>)]<sub>m</sub>-C(A)=NH, -[N(R<sub>3</sub>)]<sub>m</sub>-C(A)=NC<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> alkyl, A, -X-U oder -XQ substituiert ist, R<sub>2</sub> bedeutet ferner C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkenyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>n</sub> Cycloalkenyl, welches unsubstituiert oder durch Halogen substituiert ist, oder einen Rest -(E)<sub>m</sub>U oder -(E)<sub>m</sub>Q;  
 m ist Null oder 1;  
 Y ist Sauerstoff, Schwefel, SO oder SO<sub>2</sub>.
- 25       A ist ein Rest -N(R<sub>3</sub>)R<sub>4</sub>,  
 D ist ein Rest -N(R<sub>3</sub>)N(R<sub>4</sub>)(CO)<sub>m</sub>R<sub>5</sub>;
- 30       R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> sind unabhängig voneinander je Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub> Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub> Alkoxyalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkylthio, Cyan, einen Rest -COOR<sub>10</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkylcarbamoyl, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkylcarbamoyl, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkylamino, Piperidinocarbonyl, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidino oder Pyrrolidino substituiert ist; R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> sind ferner C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkenyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub> Cycloalkenyl, welches unsubstituiert oder substituiert ist durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub> Cycloalkenyl, oder einen Rest Cyan, -COOR<sub>10</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkylcarbamoyl, oder Piperidinocarbamoyl substituiert ist, R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> sind ferner C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkinyl, welches unsubstituiert oder durch U substituiert ist, oder R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> bedeuten einen Rest -(E)<sub>m</sub>U oder -(E)<sub>m</sub>Q;
- 35       R<sub>5</sub> und R<sub>6</sub> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bilden auch einen gesättigten oder ungesättigten 5 - 9gliedrigen Heterocyclus, der ein-oder mehrfach durch Sauerstoff, Schwefel, Stickstoff, -NH-, -NC<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkyl, -CO- oder -C(OR<sub>1</sub>)OR<sub>2</sub>- unterbrochen und durch Halogen, Cyan, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkylamino, oder einen Rest -COOR<sub>10</sub> substituiert sein kann;  
 R<sub>5</sub> und R<sub>6</sub> sind unabhängig voneinander je Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub> Alkoxy;
- 40       R<sub>7</sub> und R<sub>8</sub> sind unabhängig voneinander je C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkyl oder R<sub>9</sub> und R<sub>10</sub> bilden zusammen eine 2 - 4 gliedrige Alkylenkette,
- 45       R<sub>7</sub> und R<sub>8</sub> sind unabhängig voneinander je Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>n</sub> Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub> Cycloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub> Alkinyl, C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub> Alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub> Alkoxyalkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Halogenalkyl, -(C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkyl)<sub>m</sub>U, -(C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkyl)<sub>m</sub>Q, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Halogenalkoxy C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkyl;  
 U ist ein Phenyl-oder Naphthylrest, der unsubstituiert oder ein-oder mehrfach durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkyl, -Y-C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Halogenalkoxy, Cyan, Nitro, -COOH, -COOR<sub>10</sub>, -CONH<sub>2</sub>, -CONHR<sub>10</sub>, -CON(R<sub>3</sub>), SO<sub>2</sub>NHR<sub>10</sub>, SO<sub>2</sub>N(R<sub>3</sub>), Pyrrolidino, Piperidino, Pyrrolidinocarbonyl oder Piperidinocarbonyl substituiert ist;
- 50       E ist eine C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkylen, C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub> Alkenylenkette, die unsubstituiert oder durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Halogenalkoxy oder einen Rest -CO(O)<sub>m</sub>R<sub>10</sub>, (CO)<sub>m</sub>-A, -(CO)<sub>m</sub>Q substituiert und/oder durch ein Glied -CO- oder -C(OR<sub>1</sub>)OR<sub>2</sub>- unterbrochen ist, Q ist ein gesättigter oder ungesättigter 5 - 12 gliedriger Heterocyclus, der 1 - 4 Heteroatome oder eine Sulfinyl-oder Sulfonylgruppe auch in Kombination mit 1 - 2 Heteroatomen enthalten kann, der durch eine oder zwei Carbonylgruppen unterbrochen und benzanneliert sein kann.
- 55       4. Neue 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazolyl-5-carbonsäurederivate der Formel Ia



worin

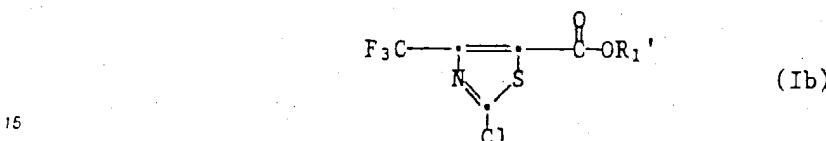
- R<sub>1</sub> einen Rest Cyan, -COXR<sub>1</sub>, -CONR<sub>1</sub>R<sub>2</sub> oder -COD bedeutet, worin R<sub>1</sub>, D und X die oben gegebene Bedeutung haben und R<sub>1</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Cycloalkyl unsubstituiert, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> substituiert durch Halogen, eine Gruppe -YR<sub>2</sub>, A, Nitro, -N(R<sub>3</sub>)COA, -[N(R<sub>3</sub>)]<sub>m</sub>-C(A) = NC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> Alkyl, -[N(R<sub>3</sub>)]<sub>m</sub>-C(A) = NH oder -[N(R<sub>3</sub>)]<sub>m</sub>-CO-N[(CO)<sub>m</sub>R<sub>2</sub>]-N(R<sub>3</sub>), -[N(R<sub>3</sub>)]<sub>m</sub>-CON[(CO)<sub>m</sub>R<sub>3</sub>]-N(R<sub>3</sub>)<sub>m</sub>-(CO)<sub>m</sub>R<sub>4</sub>, in welchem Rest einer der Indices m Null sein muss, ferner kann der C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, Alkyl-oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> Cycloalkylrest substituiert sein durch Cyano, einen Rest -C(X)<sub>m</sub>-XR<sub>10</sub>, -XCXR<sub>10</sub>, -(X)<sub>m</sub>-CXA, -(X)CXN(R<sub>3</sub>)N(R<sub>3</sub>)R<sub>4</sub>, -CHA-COOR<sub>10</sub>, -C(OR<sub>10</sub>)(OR<sub>10</sub>)R<sub>4</sub>, -PO(R<sub>5</sub>)R<sub>6</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-Cycloalkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> Cycloalkenyl; mit der Massgabe, dass -XR<sub>1</sub> nicht C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> Halogenalkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxyalkoxy, Phenylthio, Benzyloxy ist, es sei denn, diese Reste seien substituiert. R<sub>1</sub> darf auch nicht substituiertes oder unsubstituiertes Phenoxy sein; R<sub>1</sub> bedeutet ferner C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Alkenyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> Cycloalkenyl, welches unsubstituiert oder substituiert ist durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Alkylothio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Halogenalkyl oder einen Rest -CO(O)<sub>m</sub>-R<sub>10</sub>, -COA, -CON(A)R<sub>10</sub> oder -PO(R<sub>10</sub>)R<sub>4</sub>, mit der Massgabe, dass -XR<sub>1</sub> nicht einen unsubstituierten C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkenyloxyrest bedeutet, R<sub>1</sub> ist ferner C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Alkinyl, welches unsubstituiert ist, falls X Schwefel bedeutet, R<sub>1</sub> ist auch ein Rest (E)<sub>m</sub>-U oder -(E)<sub>m</sub>-Q, R<sub>1</sub> C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> Alkylothio, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> Alkoxyalkoxy, Halogen, Cyan oder einen Rest -CX(X)<sub>m</sub>R<sub>10</sub>, -(X)<sub>m</sub>-CX-A, -(X)<sub>m</sub>CXR<sub>10</sub>, N(R<sub>3</sub>)COA, -[N(R<sub>3</sub>)]<sub>m</sub>-C(A) = NH, -[N(R<sub>3</sub>)]<sub>m</sub>-C(A) = NC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> Alkyl, A, -X-U oder -XQ substituiert ist, R<sub>1</sub> bedeutet ferner C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Alkenyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> Cycloalkenyl, welches unsubstituiert oder durch Halogen substituiert ist, oder einen Rest -(E)<sub>m</sub>U oder -(E)<sub>m</sub>Q;
- 25 m ist Null oder 1;
- Y ist Sauerstoff, Schwefel, SO oder SO<sub>2</sub>.
- A ist ein Rest -N(R<sub>3</sub>)R<sub>4</sub>.
- D ist ein Rest -N(R<sub>3</sub>)N(R<sub>3</sub>)(CO)<sub>m</sub>R<sub>4</sub>.
- 30 R<sub>1</sub> und R<sub>1</sub>' sind unabhängig voneinander je Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Alkoxyalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Alkylothio, Cyan, einen Rest -COOR<sub>10</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkylcarbamoyl, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkylcarbamoyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkylamino, Piperidinocarbonyl, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidino oder Pyrrolidino substituiert ist; R<sub>1</sub> und R<sub>1</sub>' sind ferner C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Alkenyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Cycloalkenyl, welches unsubstituiert oder substituiert ist durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Cycloalkenyl, einen Rest Cyan, -COOR<sub>10</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkylcarbamoyl, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkylcarbamoyl, U, Pyrrolidino-carbamoyl oder Piperidinocarbamoyl substituiert ist, R<sub>1</sub> und R<sub>1</sub>' sind ferner C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Alkinyl, welches unsubstituiert oder durch U substituiert ist, oder R<sub>1</sub> und R<sub>1</sub>' bedeuten einen Rest -(E)<sub>m</sub>-U oder (E)<sub>m</sub>-Q, mit der Massgabe, dass nur eines von R<sub>1</sub> und R<sub>1</sub>' Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkyl bedeutet;
- 35 R<sub>1</sub> und R<sub>1</sub>' zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bilden auch einen gesättigten oder ungesättigten 5 - 9 gliedrigen Heterocyclus, der ein-oder mehrfach durch Sauerstoff, Schwefel, Stickstoff, -NH-, -NC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkyl, -CO-oder -C(OR<sub>10</sub>)-OR<sub>10</sub>-unterbrochen und durch Halogen, Cyan, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkylamino, oder einen Rest -COOR<sub>10</sub> substituiert sein kann;
- 40 R<sub>1</sub> und R<sub>1</sub>' unabhängig voneinander je Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkoxy;
- R<sub>1</sub> und R<sub>1</sub>' sind unabhängig voneinander je C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkyl oder R<sub>1</sub> und R<sub>1</sub>' bilden zusammen eine 2 - 4 gliedrige Alkenenkette,
- 45 R<sub>1</sub> und R<sub>1</sub>' sind unabhängig voneinander je Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Alkoxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>Alkoxyalkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> Halogenalkyl, -(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkyl)<sub>m</sub>U, -(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkyl)<sub>m</sub>Q, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkyl;
- 50 U ist ein Phenyl-oder Naphthylrest, der unsubstituiert oder ein-oder mehrfach durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkyl, -Y-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> Halogenalkoxy, Cyan, Nitro, -COOH, -COOR<sub>10</sub>, -CONH<sub>2</sub>, -CONHR<sub>10</sub>, -CON(R<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>NHR<sub>10</sub>, SO<sub>2</sub>N(R<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, Pyrrolidino, Piperidino, Pyrrolidinocarbonyl oder Piperidinocarbonyl substituiert ist;
- 55 E ist eine C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkylen, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>Alkenylenkette, die unsubstituiert oder durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>Alkylothio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> Halogenalkoxy oder einen Rest -CO(O)<sub>m</sub>R<sub>10</sub>, -(CO)<sub>m</sub>-A, -(CO)<sub>m</sub>Q substituiert und/oder durch ein Glied -CO-oder -C(OR<sub>10</sub>)-OR<sub>10</sub>-unterbrochen ist;
- Q ist ein gesättigter oder ungesättigter 5 - 12 gliedriger Heterocyclus, der 1 - 4 Heteroatome oder eine Sulfinyl-oder Sulfonylgruppe auch in Kombination mit 1 - 2 Heteroatomen enthalten kann, der durch eine oder zwei Carbonylgruppen unterbrochen und benzanneliert sein kann.

## 5. Fungizides Mittel gemäss Anspruch 1 der Formel Ib



worin R<sub>1</sub> die im Anspruch 3 gegebene Bedeutung hat.

## 10 6. Neue 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäurederivate der Formel Ib



worin R'<sub>1</sub> C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub>Cycloalkyl unsubstituiert oder substituiert durch Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkyl-, oder C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub>Cycloalkyl substituiert durch eine Gruppe XR<sub>2</sub>, A, Nitro, -N(R<sub>2</sub>)COA, -[N(R<sub>2</sub>)]<sub>m</sub>-C-(A) = N-C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkyl, -N(R<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-C(A) = NH, oder [N(R<sub>2</sub>)]<sub>m</sub>-CON[(CO)<sub>m</sub>R<sub>3</sub>]-NR<sub>3</sub>, -[N(R<sub>2</sub>)]<sub>m</sub>-CON[(CO)<sub>m</sub>R<sub>3</sub>]-N(R<sub>3</sub>)- (CO)<sub>m</sub>R<sub>4</sub>, in welchem Rest einer der Indices m Null sein muss, ferner kann der C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkyl-oder C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub>Cycloalkylrest substituiert sein durch Cyano, einen Rest -C(X)<sub>m</sub>-XR<sub>10</sub>, -XCXR<sub>10</sub>, -(X)<sub>m</sub>-CXA, -(X)CXN(R<sub>2</sub>)N(R<sub>3</sub>)-R<sub>4</sub>, -CHA-COOR<sub>10</sub>, -C(OR<sub>2</sub>)(OR<sub>3</sub>)R<sub>4</sub>, PO(R<sub>2</sub>)R<sub>4</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Cycloalkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub>Cycloalkenyl. R'<sub>1</sub> bedeutet ferner einen unsubstituierten C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkenyl-oder C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub>Cycloalkenylrest oder einen C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkenyl-oder C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub>Cycloalkenylrest, der substituiert ist durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkythio, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Halogenalkyl oder einen Rest -CO(O)<sub>m</sub>-R<sub>10</sub>, -COA, -CON(A)R<sub>10</sub> oder -PO(R<sub>2</sub>)R<sub>4</sub>. R'<sub>1</sub> ist ferner C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkinyl, welches unsubstituiert ist oder ein Rest -(E)<sub>m</sub>U oder -(E)<sub>m</sub>Q mit der Massgabe, dass (E)<sub>m</sub>U nicht einen unsubstituierten Benzylrest oder einen unsubstituierten oder substituierten Phenylrest bedeutet, während m, X, Y, A, D, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>6</sub>, R<sub>7</sub>, R<sub>8</sub>, R<sub>9</sub>, R<sub>10</sub>, U, E und Q die unter der Formel Ia gegebene Bedeutung haben.

20 7. 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-carbonsäurederivate der Formel Ib gemäss Anspruch 6, worin R'<sub>1</sub> einen C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylrest bedeutet, der substituiert ist durch Halogen, Cyan, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkythio, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkoxy carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylsulfonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub>Cycloalkyl oder Cycloalkenyl, oder einen Rest -(E)<sub>m</sub>U oder -(E)<sub>m</sub>Q, wobei E, m, Q und U die im Anspruch 3 gegebene Bedeutung hat.

25 8. 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-carbonsäurederivate der Formel Ib gemäss Anspruch 6, worin R'<sub>1</sub> den Tetrahydropyran-2-ylmethyl-

30 2,2-Dimethyl-1,3-dioxolan-4-ylmethyl-

1,2-Dihydrobenz-1,4-dioxan-2-ylmethyl-

Thiophen-2-ylmethyl-

3,4 Methylendioxybenzyl-

5-Methylthiazol-4-ylethyl-

40 para Tolyl-eth-1-yl

Bornyl-

Norbornyl-

Fenichyl-

Menthyl-

45 Cyanoethyl-

Phenoxyethyl-

Methylsulfonylethyl

Phenylthioethyl-

50 Ethoxycarbonylmethyl-

Ethoxycarbonyleth-1-yl-

5,5-Diemthyl-tetrahydrofuran-2-on-3-yl-

2-Oxopyroolinomethyl-

$\alpha$ -Methoxycarbonyl-benzyl-

55  $\alpha$ -Cyano-benzyl-

$\alpha$ -Benzoyl-benzyl-oder

$\alpha$ -Methoxycarbonyl- $\alpha$ -phenyl-benzyl-oder den Morphinomethylrest bedeutet.

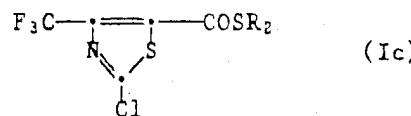
9. 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-carbonsäurederivate der Formel Ib gemäss Anspruch 6, worin R<sub>1</sub> einen C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub> Alkyrest bedeutet, der durch -(X)<sub>m</sub>-CX-A substituiert ist, wobei A, X und m die im Anspruch 3 gegebene Bedeutung haben.

10. 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-carbonsäurederivate gemäss Anspruch 9, worin m Null, X Sauerstoff 5 bedeutet, während A die im Anspruch 3 gegebene Bedeutung hat.

11. 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäurederivat gemäss Anspruch 9, worin R<sub>1</sub> den Azepinoylmethyl-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(methoxycarbonyl-eth-1-yl)-carbamoyl-methyl-oder den 2-Piperidino-eth-1-ylrest bedeutet.

12. Fungizides Mittel gemäss Anspruch 1 der Formel Ic

10

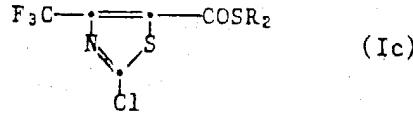


15

worin R<sub>2</sub> die im Anspruch 3 gegebene Bedeutung hat.

13. Neue 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-thiocarbonsäurederivate der Formel Ic

20

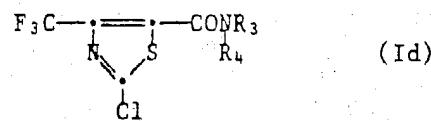


25

worin R<sub>2</sub> die im Anspruch 3 gegebene Bedeutung hat.

14. Fungizides Mittel gemäss Anspruch 1 der Formel Id

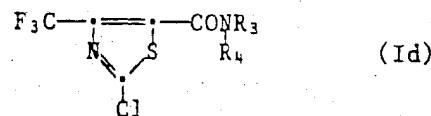
30



worin R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> die im Anspruch 3 gegebene Bedeutung haben.

15. Neue 2-Chlor-4-trifluormethyl-5-carbonsäureamide der Formel Id

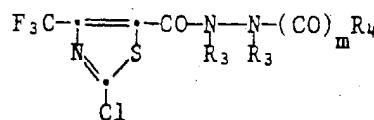
40



worin R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> unabhängig voneinander je Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Cycloalkyl, welches unsubstituiert oder durch C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkoxyalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylthio, Cyano, einen Rest -COOR<sub>1</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylcarbamoyl; Di-C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylcarbamoyl, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylamino, Piperidinocarbonyl, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidino oder Pyrrolidino substituiert ist; R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> sind ferner C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkenyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Cycloalkenyl, welches unsubstituiert oder substituiert ist durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Cycloalkenyl, oder einen Rest Cyan, -COOR<sub>1</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylcarbamoyl, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylcarbamoyl, U, Pyrrolidino-carbamoyl oder Piperidinocarbamoyl substituiert ist; R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> sind ferner C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkinyl, welches unsubstituiert oder durch U substituiert ist, oder R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> bedeuten einen Rest -(E)<sub>m</sub>-U oder -(E)<sub>m</sub>-Q, sind, mit der Massgabe, dass nur eines von beiden Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkyl ist, und

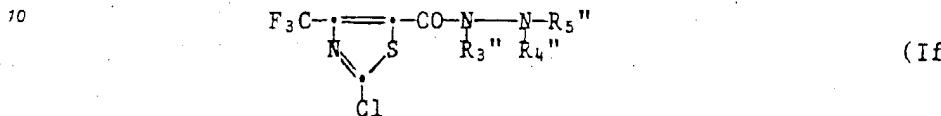
R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bilden auch einen gesättigten oder ungesättigten 5 - 9 gliedrigen Heterocyclus, der ein-oder mehrfach durch Sauerstoff, Schwefel, Stickstoff, -NH-, -NC-, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkyl, -CO- oder -C(OR<sub>1</sub>)OR<sub>2</sub>-unterbrochen und durch Halogen, Cyan, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>Alkylamino, oder einen Rest -COOR<sub>1</sub>, substituiert sein kann.

16. Neue 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäurehydrazide der Formel Ie



worin m, die R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> unabhängig voneinander eine im Anspruch 3 gegebene Bedeutung haben.

17. Neue 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäurehydrazide der Formel If



15 worin R<sub>3</sub>'' R<sub>4</sub>'' und R<sub>5</sub>'' unabhängig voneinander je Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyl bedeuten, wobei Phenyl und Benzyl unsubstituiert, oder durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Haloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Haloalkoxy, Nitro, Carboxyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyxcarbonyl, Carbamoyl, Methylcarbamoyl substituiert sind R<sub>3</sub>'' und R<sub>4</sub>'' zusammen auch eine 4-5gliedrige Alkylenkette bilden, die durch Sauerstoff, Schwefel, Imino oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylimino unterbrochen und durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl ein-oder mehrmals substituiert sein kann, bedeuten.

20 18. 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-carbonsäureamide der Formel Id gemäß Anspruch 15, worin -N(R<sub>3</sub>)-R<sub>4</sub> den  
R<sub>3</sub> den  
-N-2,4-Dichlorbenzyl-N-methylcarbamoyl-,  
-N-Benzyl-N-isopropylcarbamoyl-,  
25 -N-Cyclohexyl-N-methoxycarbamoylethyl-carbamoyl-,  
-N-2,6-Dimethylphenyl-N-methoxycarbamoylethyl-carbamoyl oder den -N-(1-Cyanopent-1-yl)-N-methylcarbamoylrest bedeutet.

30 19. Verfahren zur Herstellung der 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäurederivate der Formel Ia, Anspruch 4, dadurch gekennzeichnet, dass man Trifluoracetonitril im siedenden Lösungsmittel mit einem Acetoessigsäureester, in Gegenwart von Natriumacetat als Katalysator kondensiert, den entstandenen 2-Amino-3,3,3-trifluorbut-2-ensäureester mit Chlorcarbonylsulfenylchlorid ringschließt, den entstandenen 2-Oxo-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäureester mit Phosphortrichlorid behandelt und das entstandene 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäurechlorid in bekannter Weise in ein 2-Chlor-4-trifluormethyl-thiazol-5-carbonsäurederivat der Formel Ia umsetzt.

35 20. Verfahren zur Herstellung eines Mittels gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man einen Wirkstoff der Formel I mit geeigneten festen oder flüssigen Zusatzstoffen und Tensiden innig vermischt.

40 21. Verfahren zur Bekämpfung oder Verhütung eines Befalls von Kulturpflanzen durch phytopathogene Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man eine gemäß den Ansprüchen 1 bis 12 definierte Verbindung der Formel I auf die Pflanze oder deren Standort appliziert.

22. Verwendung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder sie enthaltender Mittel zur Bekämpfung und/oder zur präventiven Verhütung eines Befalls von Mikroorganismen.

23. Verwendung gemäß Anspruch 22, dadurch gekennzeichnet, dass es sich bei den Mikroorganismen um phytopathogene Pilze handelt.

45 24. Verfahren gemäß Anspruch 21, dadurch gekennzeichnet, dass die Pflanzenteile das Saatgut sind.

25. Verfahren gemäß Anspruch 21, dadurch gekennzeichnet, dass Reispflanzen behandelt werden.

26. Verwendung gemäß Anspruch 22, dadurch gekennzeichnet, dass es sich bei den Mikroorganismen um bodenbürtige phytopathogene Bakterien handelt.

50

55



Europäisches  
Patentamt

# EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

Nummer der Anmeldung

EP 88 10 1183

## EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE

Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile	Betrifft Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int. Cl.4)
D, X	GB-A-2 020 662 (MONANTO) * Ansprüche 1-12 *	1-7, 14- 16	C 07 D 277/56 A 01 H 43/78
D, X	EP-A-0 044 201 (MONSANTO) * Ansprüche *	1-4, 12, 13	C 07 D 417/12 C 07 F 9/65
D, X	EP-A-0 027 018 (MONSANTO) * Ansprüche; Seiten 10, 11 *	1-7, 14- 16	
D, X	EP-A-0 064 353 (MONSANTO) * Ansprüche *	1-7, 14- 16	
D, A	US-A-3 725 427 (W.A. HARRISON) * Insgesamt *	1	
			RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int. Cl.4)
			C 07 D 277/00 A 01 N 43/00
Der vorliegende Recherchenbericht wurde für alle Patentansprüche erstellt			
Rechercheort	Abschlußdatum der Recherche	Prüfer	
DEN HAAG	28-04-1988	HENRY J.C.	
KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTE			
X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet	T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze		
Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie	E : älteres Patentdokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist		
A : technologischer Hintergrund	D : in der Anmeldung angeführtes Dokument		
O : handschriftliche Offenbarung	L : aus andern Gründen angeführtes Dokument		
P : Zwischenliteratur	& : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument		